

(12)特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関 国際事務局



(43) 国際公開日 2004 年4 月22 日 (22.04.2004)

PCT

(10) 国際公開番号 WO 2004/033463 A1

(51) 国際特許分類?: C07D 498/04, 498/20, 519/00, A61K 31/424, 31/454, 31/4545, 31/4709, 31/496, 31/498, 31/4245, 31/4439, 31/497, 31/428, 31/4725, 31/438, 31/551, 31/5377, 31/506, 31/695, 31/46, A61P 31/06, C07F 7/10

(21) 国際出願番号:

PCT/JP2003/013070

(22) 国際出願日:

2003年10月10日(10.10.2003)

(25) 国際出願の言語:

日本語

(26) 国際公開の言語:

日本語

(30) 優先権データ:

特願 2002-298259

2002年10月11日(11.10.2002) Л

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 大塚 製薬株式会社 (OTSUKA PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒101-8535 東京都千代田区 神田司町2 丁目9番地 Tokyo (JP). (72) 発明者; および

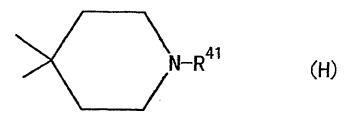
(75) 発明者/出願人(米国についてのみ): 壷内 英継 (TSUBOUCHI, Hidetsugu) [JP/JP]; 〒770-0862 徳島県 徳島市 城東町一丁目2-35 Tokushima (JP). 佐々木 博 文 (SASAKI, Hirofumi) [JP/JP]; 〒771-0201 徳島県 板 野郡 北島町北村字三町地33-15 Tokushima (JP). 黒田 英明 (KURODA, Hideaki) [JP/JP]; 〒779-3118 徳島県 徳島市 国府町井戸字前野5-7 Tokushima (JP). 糸谷 元 宏(ITOTANI, Motohiro)[JP/JP]; 〒770-0047 徳島県 徳 島市 名東町三丁目89-4 Tokushima (JP). 長谷川 武司 (HASEGAWA, Takeshi) [JP/JP]; 〒771-1211 徳島県 板 野郡 藍住町徳命字元村146-11 第一愛日ハイツ607 Tokushima (JP). 原口 佳和 (HARAGUCHI, Yoshikazu) [JP/JP]; 〒771-0130 徳島県 徳島市 川内町加賀須 野463-30 今切寮E-312 Tokushima (JP). 黒田 武志 (KURODA, Takeshi) [JP/JP]; 〒771-0205 徳島県 板野 郡 北島町江尻字夷ノ本24-13 Tokushima (JP). 松崎 敬之 (MATSUZAKI, Takayuki) [JP/JP], 〒770-0053 徳 島県 徳島市 南島田町2丁目89 Tokushima (JP). 田井

[続葉有]

(54) Title: 2,3-DIHYDRO-6-NITROIMIDAZO[2,1-b]OXAZOLES

(54) 発明の名称: 2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール化合物

$$O_2N \longrightarrow N \longrightarrow (CH_2)_nR^2 \qquad (1)$$



(57) Abstract: 2,3-Dihydro-6-nitroimidazo[2,1-b]oxazoles represented by the general formula (1): (1) (H) [wherein R^1 is hydrogen or C_{1-6} alkyl; n is an integer of 0 to 6; and R^2 is -OR³ or the like (wherein R^3 is hydrogen, C_{1-6} alkyl, or the like), or R^1 and -(CH₂)_n R^2 may be united via a nitrogen atom to form together with the adjacent carbon atom a spiro ring represented by the general formula (H) (wherein R^4 1 is hydrogen, C_{1-6} alkyl, or the like)]. The compounds exhibit excellent bactericidal activity against tubercle bacillus, multiple drug resistant tubercle bacillus, and atypical acid-fast bacteria.



国憲 (TAI,Kuninori) [JP/JP]; 〒771-0125 徳島県 徳島市 川内町金岡5-2 ラ・フォーレKAWAUCHI107 Tokushima (JP). 小松 賃 (KOMATSU,Makoto) [JP/JP]; 〒771-0219 徳島県 板野郡 松茂町笹木野字八山開拓91-5 Tokushima (JP). 松本 真 (MATSUMOTO,Makoto) [JP/JP]; 〒772-0051 徳島県鳴門市鳴門町高島字北418

Tokushima (JP). 橋詰 博之 (HASHIZUME,Hiroyuki) [JP/JP]; 〒772-0003 徳島県 鳴門市 撫養町南浜字東浜527-1 ダイアパレス鳴門1401 Tokushima (JP). 富重 辰夫 (TOMISHIGE,Tatsuo) [JP/JP]; 〒771-0142 徳島県 徳島市 川内町沖島422-1 グラン川内タワー310 Tokushima (JP). 清家 祐治 (SEIKE,Yuji) [JP/JP];

/続葉有/

(57) 要約:

本発明は、一般式(1)

$$O_2N \longrightarrow N \longrightarrow C \qquad (CH_2)_nR^2 \qquad (1)$$

[上記一般式(1)中、 R^1 は水素原子又は $C1\sim6$ アルキル基を示す。nは $0\sim6$ の整数を示す。 R^2 は基 $-OR^3$ 等を示す。ここで R^3 は水素原子、 $C1\sim6$ アルキル基等を示す。また、 R^1 及び- (CH_2) $_n$ R^2 は、隣接する炭素原子と共に窒素原子を介して互いに結合して上記一般式(H)で表されるスピロ環を形成していてもよい。ここで R^{41} は水素原子、 $C1\sim6$ アルキル基等を示す。] で表される 2 、3 - ジヒドロ-6 - ニトロイミダゾ [2 、1 - 1 」 オ

で表される 2, 3 - ジヒドロー 6 - ニトロイミダゾ L 2, 1 - b 」 オキサゾール化合物を提供する。本発明化合物は、結核菌、多剤耐性結核菌及び非定型抗酸菌に対して優れた殺菌作用を有する。

〒772-0017 徳島県 鳴門市 撫養町立岩字芥原1-13 Tokushima (JP). 川崎 昌則 (KAWASAKI,Masanori) [JP/JP]; 〒770-0003 徳島県 徳島市北田宮2丁目9-6-306 Tokushima (JP). 住田 卓美 (SUMIDA,Takumi) [JP/JP]; 〒770-0912 徳島県 徳島市 東新町2丁目20番地704 Tokushima (JP). 宮村伸 (MIYAMURA,Shin) [JP/JP]; 〒771-0220 徳島県 板野郡 松茂町広島字北川向二ノ越147-13 Tokushima (JP).

(74) 代理人: 浅村 皓, 外(ASAMURA,Kiyoshi et al.); 〒 100-0004 東京都 千代田区 大手町2丁目2番1号 新大手町ビル331 Tokyo (JP).

- (81) 指定国 (国内): AU, BR, BY, CA, CN, EG, ID, IN, KR, MX, PH, PL, RU, SG, UA, US, VN, ZA.
- (84) 指定国(広域): ヨーロッパ特許 (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR).

添付公開書類:

一 国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される 各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語 のガイダンスノート」を参照。

HIS PAGE BLANK (USPTO)

明 細 書

2, 3-ジヒドロー6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物

5 技術分野

本発明は、2, 3-ジヒドロイミダブ [2, 1-b] オキサゾール化合物に関する。

背景技術

抗酸菌の中で、ヒト結核菌(Mycobacterium tuberculosis)が広く知られており、人類の3分の1に感染しているといわれる。また、Mycobacterium africanum 及びMycobacterium bovisが、ヒト結核菌と同様に結核菌群として知られ、ヒトに対して強い病原性を有するマイコバクテリアとして知られている。これらの結核症に対しては、ファーストラインの薬として位置づけされているリファンピシン、イソニアジド及びエタンブトール(またはストレプトマイシ

15 ン) の3剤、もしくはこれらにピラジナミドを加えた4剤を用いた治療が施されている。

しかし、結核症の治療には極めて長期に及ぶ服薬が必要であるため、コンプライアンスが悪くなり、治療に失敗することもまれではない。

また、リファンピシンには、肝障害、フルシンドローム、薬物アレルギー、P 450関連の酵素誘導による他剤との併用禁忌、イソニアジドには末梢神経障害、リファンピシンとの併用で重篤な肝障害を誘発、エタンブトールには視神経障害による視力低下、ストレプトマイシンには第8脳神経障害による聴力の低下、ピラジナミドには肝障害、尿酸値上昇に伴う痛風発作、嘔吐等の副作用が報告されている(A Clinician's Guide To Tuberculosis, Michael D. Iseman 2000 by Lippincott Williams & Wilkins, printed in the USA, ISBN 0-7817-1749-3, 結核第2版, 久世文幸、泉 孝英、医学書院1992年)。

実際にこれらの副作用により標準の化学療法が実施できないケースが、全体 (調査対象となった全入院患者228症例)の服薬中止症例(約23%、52症 例)の70%を占めているという報告もある(Kekkaku Vol.74:77-82, 1999)。 10

特に上記ファーストラインで併用使用されている5薬剤の内、リファンピシン、イソニアジド及びピラジナミドに共通する肝毒性は、最も頻発する副作用として知られている。また一方で、抗結核剤に耐性を示す結核菌、多剤耐性となった結核菌等が増加しており、治療を更に困難にしている。

- 5 WHOの調査 (1996年~1999年) によると、世界で分離される結核菌の内、既存抗結核剤のどれかに耐性を示す割合は、19%に達し、多剤耐性結核菌も5. 1%と発表されている。このような多剤耐性結核菌に感染している保菌者は、世界で6千万人に達しているであろうといわれており、今後益々多剤耐性結核菌の増加が懸念されている (April 2001 as a supplement to the journal
- 更には、AIDS患者の死亡原因の大半が結核であり、1997年の時点で結核とHIVに混合感染しているヒトは1070万人に達していると報告されている (Global Alliance for TB drug development)。また、混合感染により、通

Tuberculosis, the "Scientific Blueprint for TB Drug Development")

常より少なくとも30倍高い結核への発症リスクを伴うと考えられている。

- 15 このような現状を踏まえ、望まれる抗結核剤のプロファイルとして、(1)多剤 耐性結核菌にも有効なもの、(2)短期化学療法を可能にするもの、(3)副作用の少ないもの、(4)潜伏感染している結核菌 (Latentな結核菌) に効力を示すもの、(5)経口投与可能なもの、等が挙げられる。
- また、近年増加してきているMAC症(Mycobacterium avium-intracellulare complex症)の原因菌である Mycobacterium avium や Mycobacterium intracellulare、また、その他 Mycobacterium kansasii、Mycobacterium marinum、Mycobacterium simiae、Mycobacterium scrofulaceum、Mycobacterium szulgai、Mycobacterium xenopi、Mycobacterium malmoense、Mycobacterium haemophilum、Mycobacterium ulcerans、Mycobacterium shimoidei、
- 25 Mycobacterium fortuitum、Mycobacterium chelonae、Mycobacterium smegmatis、 Mycobacterium aurum等の非定型抗酸菌が、ヒトに病原性を有する菌として知られている。

今日、これらの非定型抗酸菌症に対して有望な治療薬は乏しく、抗結核剤であるリファンピシン、イソニアジド、エタンブトール、ストレプトマイシン、カナ

マイシン、一般細菌感染症治療薬であるニューキノロン剤、マクロライド系抗菌剤、アミノ配糖体系抗菌剤及びテトラサイクリン系抗菌剤が組み合わせて使用されているのが現状である。

しかしながら、非定型抗酸菌症の治療には、一般細菌による感染症に比較し、 5 長期の服薬が強いられ、難治化し、死亡する症例も報告されている。このような 現状を解決するために、より強い効力を示す薬剤の開発が望まれている。

例えば、特表平11-508270号公報(WO97/01562)に、6-ニトロ-1,2,3,4-ジヒドロ[2,1-b]イミダゾピラン化合物が、インビトロにおいて結核菌(H37Rv株)及び多剤耐性結核菌に対して殺菌作用を有していること及び結核感染動物モデルに対して経口投与で治療効果を有していることから、抗結核剤として有用であることが開示されている。

しかしながら、上記文献に記載されている化合物は、本発明化合物とは基本的な骨格が異なり、非類似の化合物である。

更に、クプスワミーナガラジャン(Kuppsuwamy Nagarajan)等は、ヨーロピア

15 ン ジャーナル オブ メディシナル ケミストリー、1989年、第24巻、
第631~633 頁 (European Journal of Medicinal Chemistry 1989, Vol. 24, p631-633) に、一般式 (I)

$$O_2N \longrightarrow N \longrightarrow R^1$$

$$(CH_2)_nR^2$$

$$(1)$$

20

10

において、 R^1 が水素原子又はメチル基を示し、 $-(CH_2)_n R^2$ がクロロメチル基、 $C1\sim C7$ のアルキル基、イソプロポキシメチル基、3-プロペニルオキシメチル基、無置換のフェノキシメチル基を示す化合物並びに R^1 及び

- (CH₂)_nR²が結合してシクロペンタン環又はシクロヘキサン環を形成した た化合物(計16種類の化合物)が結核菌(H37Rv株)に対して、殺菌作用を有することを報告している。

しかしながら、上記文献には、経口投与で有効な化合物は僅かに 4 種類だけであり、その中で最も活性の高い化合物、即ち一般式(I)において R^1 が水素原子を示し、-(CH_2) $_n$ R^2 がエチルである化合物(CGI-17341)に変異原性が

見つかったため、これら一連の化合物群の薬剤としての開発を断念したとの記載がある。

更に、アンティマイクロバイアル エージェント アンド ケモセラピー、1 993年2月号、第183~186頁 (Dilip R. Astekar et. Al.,

5 Antimicrobial Agents and Chemotherapy, Feb. 1993, p183-186) には、上記 CGI-17341の抗菌プロファイル、即ち、結核菌(H37Rv株)及び多剤耐性結核菌に 対して殺菌作用を有しているものの、非定型抗酸菌属の M. avium、M. intracellulare 及び M. fortuitum に対しては250μg/ml以下では活性 を有していないことが報告されている。

10 発明の開示

本発明は、結核菌及び多剤耐性結核菌に対して優れた殺菌作用を有する化合物を提供することを目的とする。

本発明は、非定型抗酸菌に対して優れた殺菌作用を有する化合物を提供することを目的とする。

15 本発明者は、鋭意研究を重ねた結果、結核菌、多剤耐性結核菌及び非定型抗酸菌に対して優れた殺菌作用を有する新規2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール化合物の合成に成功した。本発明は、斯かる知見に基づき完成されたものである。

本発明は、一般式(1)

$$O_2N \longrightarrow N \longrightarrow O \qquad (CH_2)nR^2 \qquad (1)$$

で表わされる2、3-ジヒドロー6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩:

25 (式中、 R^1 は水素原子又は $C1\sim 6$ のアルキル基を示す。nは $0\sim 6$ の整数を示す。 R^2 は下記一般式(A)、(B)、(C)、(D)、(E)、(F)又は(G)で表わされる基を示す。また、 R^1 及び-(CH_2) $_n$ R^2 は、隣接する炭素原子と共に窒素原子を介して互いに結合して下記一般式(H)で表わされるスピロ環を形成していてもよい。)を提供する。

以下に、一般式(A)~(H)について説明する。

一般式(A)で表される基:

$$-OR^3$$
 (A)

(式中、R³は、

- 5 A1) 水素原子;
 - A2) C1~6アルキル基:
 - A3) C1~6アルコキシ-C1~6アルキル基:
 - A4) フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、フェニルC1~6アルコキシ基; ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基; ハロゲン置換もし
- 10 くは未置換のC1~6アルコキシ基及びフェノキシ基[フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基が少なくとも1個置換していてもよい]からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
 - A5) ビフェニリルC1~6アルキル基;
 - A6) フェニルC2~6アルケニル基:
- 15 A7) C1~6アルキルスルホニル基;
 - A8) C1~6アルキル基が置換していてもよいベンゼンスルホニル基:
 - A9) C1~6アルカノイル基:
 - A10) 一般式 (Aa)で表される基:

$$N-R^4$$
 (Aa)

20

(ここでR⁴は、C1~6アルコキシカルボニル基;フェニルC1~6アルコキシカルボニル基[フェニル環上には、フェニルC1~6アルコキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]又はフェニルC1~6アルキル基[フェニル環上には、フェニルC1~6アルコキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]を示す。);

A11) ビフェニリルC1~6アルコキシカルボニル基:

A12) ベンゾオキサゾリルC1~6アルキル基(ベンゾオキサゾール環上には、 少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい):

A13) ベンゾオキサゾリル基:

又は

- 5 A14) オキサゾリルC1~6アルキル基(オキサゾール環上には、フェニル基及 びC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)を示す。
 - 一般式 (B) で表される基:

$$-SR5$$
 (B)

- 10 (式中、 R^5 は、テトラゾリル基 [テトラゾール環上には、 $C1\sim6$ アルキル基 又はハロゲン原子を有することのあるフェニル基が置換していてもよい] 又はベンゾオキサゾリル基を示す)、
 - 一般式(C)で表される基:

$$-COOR^6$$
 (C)

- 15 (式中、 R^6 は $C1\sim6$ アルキル基を示す。)
 - 一般式(D)で表されるカルバモイルオキシ基:

$$-OOCNR^7R^8$$
 (D)

(式中、 R^7 及び R^8 は、同一又は異なって、

- D1) 水素原子:
- 20 D2) C1~8アルキル基;
 - D3) ハロゲン置換C1~6アルキル基;
 - D4) C1~6アルコキシカルボニル-C1~6アルキル基;
 - D5) C3~8シクロアルキル基;
 - D6) フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン
- 25 置換もしくは未置換の $C1 \sim 6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1 \sim 6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1 種が置換していてもよい):
 - D7) フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基、

C1~6アルカノイル基、カルボキシル基、C1~6アルコキシカルボニル基、フェニルC1~6アルコキシカルボニル基、カルバモイル基、C1~6アルキルカルバモイル基、アミノスルホニル基及びモルホリノ基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい);

5 D8) ナフチル基;

又は

D9) ピリジル基

を示す。

D10) R ⁷ 及び R ⁸ は、これらが隣接する窒素原子と共に、他のヘテロ原子もし 10 くは炭素原子を介し又は介することなく互いに結合して下記(D10-1)~(D10-3)に 示す飽和複素環基又は下記(D10-4)~(D10-7)に示すベンゼン縮合複素環基を形成 していてもよい。

(D10-1) 一般式 (Da) で示されるピペラジニル基:

$$-N$$
 $N-R^9$ (Da)

15

25

(ここでR⁹は、

- (Da1) 水素原子;
- (Da2) C1~6アルキル基;
- (Da3) フェニル $C1\sim6$ アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲ20 ン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
 - (Da4) フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
 - (Da5) C1~6アルコキシカルボニル基;
 - (Da6) フェニル $C1\sim6$ アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種

が置換していてもよい);

(Da7) フェニルC3~6アルケニルオキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい);

5 又は

(Da8) フェニル $C1\sim6$ アルキリデン置換アミノ基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基が少なくとも1 個置換していてもよい)

を示す。);

10 (D10-2) 一般式 (Db) で示される基:

$$-N$$
 R^{10} (Db)

(式中、点線は二重結合であってもよいことを示す。 R ¹⁰ は、

(Db1) 水素原子;

15 (Db2) フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい):

(Db3) フェノキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい) :

20 又は

(Db4) フェニルアミノ基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい)

を示す。);

(D10-3) モルホリノ基;

25 (D10-4) インドリニル基 (インドリン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい);

(D10-5) イソインドリニル基 (イソインドリン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい);

(D10-6) 1, 2, 3, 4ーテトラヒドロキノリル基(1, 2, 3, 4ーテトラ

ヒドロキノリン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい);

又は

(D10-7) 1, 2, 3, 4ーテトラヒドロイソキノリニル基(1, 2, 3, 4-5) テトラヒドロイソキノリン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい)

を示す。)

一般式(E)で表されるフェノキシ基:

$$-O \xrightarrow{(X)m} (E)$$

10

[式中、Xはハロゲン原子又は置換基として $C1\sim6$ アルキル基を有することのあるアミノ置換 $C1\sim6$ アルキル基を示す。mは $0\sim3$ の整数を示す。 R^{11} は、

- E1) 水素原子;
- E2) ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基;
- 15 E3) ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基;
 - E4) 一般式 (Ea) で表される基:

$$-$$
 (W) $o - NR^{12}R^{13}$ (Ea)

(式中、Wは基-CO-又はC $1\sim6$ アルキレン基を示す。 \circ は0又は1を示す。 R^{12} 及び R^{13} は同-又は異なって、

- 20 (Eal) 水素原子;
 - (Ea2) C1~6アルキル基;
 - (Ea3) C1~6アルカノイル基;
 - (Ea4) C1~6アルコキシカルボニル基;
- (Ea5) フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子;ハロゲ25 ン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基;ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基及びフェノキシ基[フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換し

ていてもよい。また、 $C1\sim6$ アルキル部分には、 $C1\sim6$ アルコキシイミノ基が置換していてもよい。);

- (Ea6) フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキ
- 5 シ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい); (Ea7) ベンゾイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
- (Ea8) ピリジル基 (ピリジン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換し 10 ていてもよい);
 - (Ea9) フェニル $C1\sim6$ アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン間換もしくは未置換 $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
- 15 (Ea10) フェノキシC 1~6 アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1~6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい);

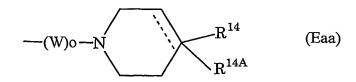
又は

20 (Eal1) ベンゾイルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)

を示す。);

- 25 E5) イミダゾリル基;
 - E6) トリアゾリル基;
 - E7) モルホリノ基;
 - E8) チオモルホリノ基;
 - E9) s-オキシドチオモルホリノ基;

E10) 一般式 (Eaa) で示されるピペリジル基:



5 (式中、W及び o は前記に同じ。 R^{14A} は、水素原子、水酸基、 $C1\sim6$ アルコキシ基又はフェニル基[フェニル環上には、ハロゲン原子が置換していてもよい。]を示す。点線は二重結合であってもよいことを示す。点線が二重結合を示すときは、 R^{14} のみが置換しているものとする。 R^{14} 及び R^{14A} は、これらが隣接する炭素原子と共に互いに結合して $C1\sim4$ アルキレンジオキシ基を形成10 してもよい。 R^{14} は、

(Eaal) 水素原子;

(Eaa2) C1~6アルコキシカルボニル基;

(Eaa3) フェノキシ基(フェニル環上には、ハロゲン原子;ハロゲン置換もしく は未置換のC1~6アルキル基;ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコ キシ基; C1~4アルキレンジオキシ基; C1~6アルコキシカルボニル基; シ **1**5 アノ基:C2~6アルケニル基:ニトロ基:フェニル基:置換基としてフェニル 基、C1~6アルキル基、カルバモイル基及びC1~6アルカノイル基からなる 群より選ばれた基を有することのあるアミノ基; C1~6アルカノイル置換C1 6アルキル基:水酸基;C1~6アルコキシカルボニル置換C1~6アルキル 基:フェニルC1~6アルキル基:C1~6アルカノイル基;C1~6アルキル 20 チオ基; 1, 2, 4-トリアゾリル基; イソオキサゾリル基; イミダゾリル基; ベンゾチアゾリル基:2H-ベンゾトリアゾリル基:ピロリル基;ベンゾオキサ ゾリル基;ピペラジニル基 [ピペラジン環上には、置換基としてC1~6アルコ キシカルボニル基及びフェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲ ン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未 25 置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換 していてもよい)からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していても よい]:ピペリジル基[ピペリジン環上には、少なくとも1個のアミノ基が置換 していてもよい。該アミノ基上には置換基としてC1~6アルキル基及びフェニ

ル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。〕及びカルバモイル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

(Eaa4) 水酸基:

(Eaa5) カルボキシ基;

(Eaa6) フェニル基 (フェニル環上には、置換基としてフェノキシ基 [フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アル10 キル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい); (Eaa7) C1~6アルコキシ基;

15 (Eaa8) C3~8シクロアルキル-C1~6アルコキシ基;

(Eaa9) フェニルカルバモイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン 置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6ア ルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよ い);

20 (Eaa10) テトラヒドロピラニルオキシ基;

(Eaal1) 1, 3-ジオキソラニル基;

(Eaa12) オキソ基;

(Eaa13) ナフチルオキシ基(ナフタレン環上には、少なくとも1個の $C1\sim6$ アルキル基が置換していてもよい);

25 (Eaa14) 2, 3-ジヒドロベンゾフリルオキシ基(2, 3-ジヒドロベンゾフラン環上には、C1~6アルキル基及びオキソ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

(Eaal5) ベンゾチアゾリルオキシ基(ベンゾチアゾール環上には、少なくとも1 個の $C1\sim6$ アルキル基が置換していてもよい);

(Eaa16) 1, 2, 3, 4ーテトラヒドロナフチルオキシ基(1, 2, 3, 4ーテトラヒドロナフタレン環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい);

(Eaa17) 1, 3 - ベンゾオキサチオラニルオキシ基(1, 3 - ベンゾオキサチオラン環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい);

(Eaa18) イソキノリルオキシ基;

(Eaa19) ピリジルオキシ基;

(Eaa20) キノリルオキシ基(キノリン環上には、少なくとも1個の $C1\sim6$ アルキル基が置換していてもよい);

10 (Eaa21) ジベンゾフリルオキシ基:

(Eaa23) ベンゾイソオキサゾリルオキシ基:

(Eaa24) キノキサリルオキシ基;

15 (Eaa25) 2, 3-ジヒドロー1H-インデニルオキシ基(2, 3-ジヒドロー1H-インデン環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい); (Eaa26) ベンゾフラザニルオキシ基;

又は

(Eaa27) フェニルC 2~6アルケニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハ 20 ロゲン置換又は未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)

を示す。];

E11) 一般式 (E a b) で表される基:

 $--(W_1)o-N \qquad \qquad N---R^{15} \qquad \qquad (Eab)$

[式中、oは前記に同じ。 W_1 は、低級アルキレン基を示す。 R^{15} は、(Eabl) 水素原子;

(Eab2) C1~6アルキル基(アルキル基上には、モルホリノ基、ベンゾイル基、 置換基としてC1~6アルキル基を有することのあるカルバモイル基又はシアノ 基が置換していてもよい);

(Eab3) C3~8シクロアルキル基;

- 5 (Eab4) フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、フェニル基、ニトロ基、C1~6アルキルチオ基、C1~6アルキルスルホニル基、フェニルC1~6アルコキシ基、C2~6アルカノイルオキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基及び1,2,3ーチアジアゾール基からなる群より選ば10 れた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
 - (Eab5) C2~6アルケニル基;
 - (Eab6) フェニル基(フェニル環上にハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよ
- 15 V);

20

- (Eab7) C1~6アルカノイル基;
- (Eab9) ベンゾイル基 (ベンゼン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい); (Eab10) $C1\sim2$ 0 アルコキシカルボニル基 (アルコキシ基上には、ハロゲン原
- 25 子、置換基として $C1\sim6$ アルキル基を有することのあるアミノ基及び $C1\sim6$ アルコキシ置換 $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1 種が置換していてもよい);
 - (Eab11) フェニル $C1\sim6$ アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基、ハロゲン置換もし

5

20

くは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基、ニトロ基、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキルチオ基、 $C1\sim6$ アルカノイル基を有することのあるアミノ基、フェニル $C1\sim6$ アルコキシ基、 $C1\sim6$ アルコキシカルボニル基及び1, 2, 3 ーチアジアゾリル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1 種が置換していてもよい);

(Eab12) フェニルC 3~6Tルケニルオキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1~6Tルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6Tルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

10 (Eab13) フェノキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン 置換もしくは未置換 $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1 種が置換していてもよい);

(Eab14) フェニル $C1\sim6$ アルキルカルバモイル基(フェニル環上には、ハロゲ 15 ン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種 が置換していてもよい);

(Eab15) フェニルカルバモイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン 置換もしくは未置換 $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい):

(Eab16) ベンゾフリル置換C1~6アルコキシカルボニル基 (ベンゾフラン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい。);

(Eab17) ベンゾチエニルC1~6アルコキシカルボニル基 (ベンゾチオフェン環 25 上には、ハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基 からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

(Eab18) ナフチル置換C1~6アルコキシカルボニル基;

(Eab19) ピリジル置換C1~6アルコキシカルボニル基(ピリジン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい);

(Eab20) フリル置換 $C1\sim6$ アルコキシカルボニル基(フラン環上には、少なくとも1個のニトロ基が置換していてもよい);

(Eab21) チエニル置換 $C1\sim6$ アルコキシカルボニル基(チオフェン環上には、 少なくとも1 個のハロゲン原子が置換していてもよい);

5 (Eab22) チアゾリル置換 $C1\sim6$ アルコキシカルボニル基(チアゾール環上には、 $C1\sim6$ アルキル基及びフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは 未置換の $C1\sim6$ アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい] からなる群 より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

(Eab23) テトラゾリル置換C1~6アルコキシカルボニル基(テトラゾール環上 10 には、C1~6アルキル基及びフェニル基[フェニル環上には、少なくとも1個 のハロゲン原子が置換していてもよい]からなる群より選ばれた基の少なくとも 1種が置換していてもよい);

(Eab24) 2, 3-ジヒドロ-1H-インデニルオキシカルボニル基;

(Eab25) アダマンタン置換C1~6アルコキシカルボニル基;

15 (Eab26) フェニルC3~6アルキニルオキシカルボニル基;

(Eab27) フェニルチオC1~6アルコキシカルボニル基:

(Eab28) フェニルC1~6アルコキシ置換C1~6アルコキシカルボニル基;

(Eab29) C2~6アルケニルオキシカルボニル基;

(Eab30) C2~6アルキニルオキシカルボニル基;

20 (Eab31) C3~8シクロアルキル置換C1~6アルコキシカルボニル基; 又は

(Eab32) ベンゾイル置換C1~6アルコキシカルボニル基

を示す。);

E12) 一般式 (Eb) で表される基:

 $N-R^{16}$ (E

(式中、点線は二重結合であってもよいことを示す。 R^{16} は、 R^{15} と同一の基を示す。)

E13) 一般式 (E c) で示される基:

$$-C - N N - R^{17}$$
 (Ec)

5 (式中、R¹⁷は、

(Ec1) フェニル $C1\sim6$ アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1 種が置換していてもよい);

10 (Ec2) C1~6アルコキシカルボニル基;

又は

- (Ec3) フェニルC1~6アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が
- 15 置換していてもよい)

を示す。);

E14) ピリジル基;

E15) 一般式 (E e) で示される基:

$$-0 - N-R^{46}$$
 (Ee)

20 (式中、R ⁴⁶は、フェニル基 [フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい];フェニルC 1~6アルキル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい];フェニルC 1~6アルコキシカルボニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]又はC 1~6アルコキシカルボニル基を示

す。);

E16) フェノキシ基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

- 5 E17) ベンゾイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは 未置換 $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキ シ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
- E18) 8-アザビシクロ[3, 2, 1] オクチル基(8-アザビシクロ[3, 2, 1] オクタン環上には、少なくとも1個のフェノキシ基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)が置換していてもよい);
 - E19) 一般式 (Ef) で示される基:

$$-CH = N - NR^{47}R^{48}$$
 (E f)

15 (式中、R ⁴⁷及びR ⁴⁸は、同一又は異なって、水素原子; C1~6アルキル 基; フェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置 換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基 からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] 又はピリジル基 [ピリジン環上には、置換基としてハロゲン置換もしくは未置換C1~6ア ルキル基を少なくとも1個が置換していてもよい] を示す。また、このR ⁴⁷及びR ⁴⁸は、これらが隣接する窒素原子と共に、他のヘテロ原子を介し又は介することなく互いに結合して5~7員環の飽和複素環を形成してもよい。該複素環上には、置換基として少なくとも1個のフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]が置換していてもよい。);

E20) フェニルC $1\sim 6$ 7 ν $1\sim 6$ 7 ν $1\sim 6$ $1\sim 6$

てもよい);

E21) アミノ置換C2~6アルケニル基(該アミノ基上には、C1~6アルキル基及びフェニル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]からなる群より選ばれる基の少なくとも1種が置換していてもよい);又は

E22) オキサゾリジニル基 (オキサゾリジン環上には、少なくとも1個のオキソ 基が置換していてもよい) を示す。]

10

一般式 (F) で表される基:

$$-NR^{19}R^{20}$$
 (F)

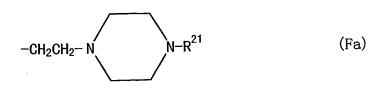
「式中、 R^{19} 及び R^{20} は、同一又は異なって、

F1) 水素原子;

15 F2) C1~6アルキル基;

F3) フェニルC1~6アルキル基 (フェニル環上には、フェノキシ基 [フェニル 環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及び ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基 の少なくとも1種が置換していてもよい];ハロゲン原子;ハロゲン置換もしく は未置換のC1~6アルキル基;ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコ 20 キシ基;アミノ基(アミノ基上には、C1~6アルキル基及びフェニルC1~6 アルキル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基から なる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]からなる群より 選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。);ピペラジニル基[ピペ 25ラジン環上には、少なくとも1個のフェニルC1~6アルキル基(フェニル環上 には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロ ゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少 なくとも1種が置換していてもよい)が置換していてもよい]及びピペリジル基 [ピペリジン環上には、少なくとも1個のアミノ基が置換していてもよい。該アミノ基上には、フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)

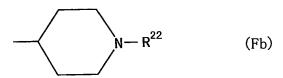
- 5 及びC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。] なる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
 - F4)フェノキシC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の
- 10 $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1 種が置換していてもよい);
 - F5) アミノC1~6アルキル基(アミノ基上には、C1~6アルキル基、C1~6アルコキシカルボニル基及びフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子もしくはハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基からなる群より選ばれ
- 15 た基の少なくとも1種が置換していてもよい]からなる群より選ばれた基の少な くとも1種が置換していてもよい);
 - F6) フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、フェノキシ基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の
- 20 少なくとも1種が置換していてもよい]及びC1~6アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
 - F7) C1~6アルコキシカルボニル基:
 - F8) フェニルC1~6アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしく
- 25 は未置換の $C1 \sim 6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい):
 - F9) 一般式 (Fa) で表される基:



(ここで、R²¹は、C1~6アルコキシカルボニル基;フェニルC1~6アル コキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)又はフェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)を示す。);

F10) 一般式 (Fb) で表される1-置換-4-ピペリジル基:

15



(ここで、 R^{22} は、 $C1\sim6$ アルコキシカルボニル基;フェニル $C1\sim6$ アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは スピ換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)又はフェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基又はハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)を

25 示す。);又は

F11) ピペリジルC1~6アルキル基(ピペリジン環上には、少なくとも1個のフェノキシ基(フェニル環上には、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい)が置換していてもよい)を示す。:

5

10

F12)更に、 R^{19} 及び R^{20} は、これらが隣接する窒素原子と共に、他のヘテロ原子もしくは炭素原子を介し又は介することなく互いに結合して下記(F12-1)~(F12-10)に示す複素環を形成していてもよい。;

(F12-1) 一般式 (Fc) で表される基:

$$-N$$
 \mathbb{R}^{23} (Fc)

[ここで、点線は二重結合であってもよいことを示す。R²³は、

(Fc1) C1~6アルキル基;

(Fc2) フェニル $C1\sim6$ アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい):

(Fc3) フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子:ハロゲン置換もしくは未 置換のC1~6アルキル基;ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ 基;置換基としてC1~6アルキル基及びフェニルC1~6アルキル基「フェニ ル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及 15 びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた 基の少なくとも1種が置換していてもよい]からなる群より選ばれる基を有する ことのあるアミノ基;フェノキシ基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲ ン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していて 20 もよい」、フェニルC1~6アルコキシ基「フェニル環上には、ハロゲン原子、 ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置 換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換し ていてもよい]及びピペリジル基[ピペリジン環上には、少なくとも1個のアミ ノ基が置換していてもよい。該アミノ基上には、フェニルC1~6アルキル基 25 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アル キル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より 選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)及びC1~6アルキル基な

20

25

る群より選ばれる基の少なくとも1種が置換していてもよい。]からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

- (Fc4) フェニルC1~6アルコキシ基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
 - (Fc5) ビフェニリルC1~6アルコキシ基;
 - (Fc6) フェニル環上に少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよいフェニルC3~6アルケニルオキシ基;
- 10 (Fc7) フェノキシ基(フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
- (Fc8) ベンゾイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは 15 未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい); (Fc9) $C1\sim6$ アルコキシカルボニル基;
 - (Fc10) フェニルC1~6アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基が少なくとも1個置換していてもよい);
 - (Fc11) フェニル環上に少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよいフェニルC1~6アルキルカルバモイル基;
 - (Fc12) フェニルカルバモイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン 置換もしくは未置換 $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい):
 - (Fc13) フェニルチオ基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基が少なくとも1個置換していてもよい);
 - (Fc14) フェニルスルホキシド(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置

換のC1~6アルコキシ基が少なくとも1個置換していてもよい);

(Fc15) ピリジルC1~6アルコキシ基:

又は

15

(Fc16) 一般式 (F c a) で表される基:

 $- (C=O) o-NR^{24}R^{25}$ (Fca)

(式中、oは前記に同じ。R²⁴及びR²⁵は、各々

(Fcal) 水素原子;

(Fca2) C1~6アルキル基;

(Fca3) フェニルC $1 \sim 6$ アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン関連もしくは未置換のC $1 \sim 6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC $1 \sim 6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい):

(Fca4) フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン 置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1 種が置換していてもよい);

(Fca5) C1~6アルカノイル基;

(Fca6) フェニル環上に少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよいフェニルC2~6アルカノイル基;

20 (Fca7) ベンゾイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

(Fca8) C1~6アルコキシカルボニル基:

25 (Fca9) フェニルC 1~6 アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

(Fca10) フェニルカルバモイル基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは

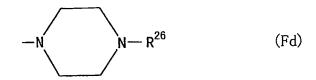
未置換の $C1\sim6$ アルキル基が少なくとも1 個置換していてもよい); 又は

(Fcall) ピペリジルオキシカルボニル基 (ピペリジン環上には、置換基としてフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル 基が少なくとも1個置換していてもよい] が少なくとも1個置換していてもよい。)

を示す。;

(Fca12) R^{24} 及び R^{25} は、これらが隣接する窒素原子を介して5~6員環 の飽和複素環を形成してもよい。該複素環上には、C1~6アルコキシカルボニ ル基;ベンゾイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは 10 未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキ シ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);フェ ノキシ基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1 ~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からな る群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);フェニルC1~ 15 6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基か らなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);フェニルC 1~6アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置 換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~ 20 6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよ い);フェニルC2~6アルケニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロ ゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換してい てもよい)及びフェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換も $\cdot 25$ しくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6ア ルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) を示す。];

F12-2) 一般式 (Fd) で表される4-置換-1-ピペラジニル基:



- 5 (式中、R²⁶は、
 - (Fd1) 水素原子;
 - (Fd2) C1~6アルキル基;
 - (Fd3) C3~8シクロアルキル基;
 - (Fd4) C3~8シクロアルキルC1~6アルキル基;
- 10 (Fd5) $C1\sim6$ アルコキシカルボニル $C1\sim6$ アルキル基;
 - (Fd6) フェニルC2~6アルケニル基;
 - (Fd7) フェニルC $1\sim6$ アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子;シアノ基;ハロゲン置換もしくは未置換のC $1\sim6$ アルキル基; C $3\sim8$ シクロアルキル基;ハロゲン置換もしくは未置換のC $1\sim6$ アルコキシ基;置換基としてC 1
- 15 ~6アルキル基を有することのあるアミノ基; C1~6アルコキシカルボニル 基; フェノキシ基; フェニルC1~6アルキル基; フェニルC2~6アルケニル 基; ピリジル基; イミダゾリル基及びピペリジル基からなる群より選ばれた基が 1~3個置換していてもよい);
- (Fd8) ビフェニリルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基及び置換基としてC1~6アルキル基を有することのあるアミノ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
 - (Fd9) ナフチルC1~6アルキル基;
- 25 (Fd10) フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子;シアノ基;置換基としてC1~6アルキル基を有することのあるアミノ基;ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基; C1~6アルコキシカルボニル基;カルボキシル基;フェノキシ基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及

5

びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた 基の少なくとも1種が置換していてもよい];アミノC1~6アルキル基[アミ ノ基上にはフェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしく は未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコ キシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)及び C1~6アルキル基からなる群より選ばれた基を少なくとも1種が置換していて もよい]及びフェニルC1~6アルコキシ基[フェニル環上には、ハロゲン原子、 ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置 換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換し ていてもよい]からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよ

- 10 (۱۷ :
 - (Fd11) ビフェニリル基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい):
- (Fd12) アミノ基、C1~6アルコキシカルボニル基が置換したアミノ基、フェ ニルC1~6アルキルアミノ基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置 15 換C1~6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい) 又はフェニルアミ ノ基(フェニル環上には、ハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC1 ~6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよ **((1)**
- 20 (Fd13) ベンゾイルC1~6アルキル基 (フェニル環上には、少なくとも1個の ハロゲン原子が置換していてもよい):
 - (Fd14) フェニルカルバモイルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲ ン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよ *۷*١) :
- (Fd15) チアゾリルC1~6アルキル基 (チアゾール環上には、ハロゲン置換も 25 しくは未置換のフェニル基及びC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基の 少なくとも1種が置換していてもよい);
 - (Fd16) オキサゾリルC1~6アルキル基 (オキサゾール環上には、ハロゲン置 換もしくは未置換のフェニル基及びC1~6アルキル基からなる群より選ばれた

基の少なくとも1種が置換していてもよい);

- (Fd17) インドリルC1~6アルキル基:
- (Fd18) フリルC1~6アルキル基(フラン環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基が少なくとも1個置換していてもよい);
- 5 (Fd19) イミダゾリルC1~6アルキル基(イミダゾール環上には、フェニル基 が置換していてもよい);
 - (Fd20) キノリルC1~6アルキル基;
 - (Fd21) テトラゾリル基 (テトラゾール環上には、フェニル基が置換していてもよい);
- 10 (Fd22) フェニル基が置換していてもよいピリミジル基:
 - (Fd23) ピリジル基:
 - (Fd24) ベンゾオキサゾリル基;
 - (Fd25) ベンゾチアゾリル基;
 - (Fd26) ベンゾオキサゾリルC1~6アルキル基(ベンゾオキサゾール環上には、
- 15 少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい);
 - (FD27) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェノキシC2~6 アルカノイル基:
 - (Fd28) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェニルチオC2~6アルカノイル基;
- 20 (Fd29) フェニルC 2~6Fルカノイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6Fルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6Fルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
 - (Fd30) ベンゾイル基(フェニル環上にはハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは
- 25 未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基及び置換基としてC1~6アルキル基を有することのあるアミノ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい):
 - (Fd31) ビフェニリルカルボニル基:
 - (Fd32) ピリジルカルボニル基;

(Fd33) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェニルC2~6アルケニルカルボニル基;

(Fd34) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェニルC1~6アルキルスルホニル基;

5 (Fd35) ベンゼンスルホニル基 (ベンゼン環上には、ハロゲン原子及びC1~6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

(Fd36) 一般式 (Fda) で表される基:

$$-COOR^{27}$$
 (Fda)

10 (式中、R²⁷は、

(Fdal) ハロゲン置換もしくは未置換のC1~8アルキル基;

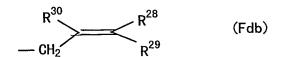
(Fda2) C3~C8シクロアルキル基;

(Fda3) C3~C8シクロアルキル-C1~6アルキル基;

(Fda4) C1~6アルコキシ-C1~6アルキル基;

15 (Fda5) C1~6アルキル基を有することのあるアミノーC1~6アルキル基:

(Fda6) 一般式 (Fdb) で表される基



20

(ここで R^{28} 、 R^{29} 及び R^{30} は、各々水素原子; $C1\sim6$ アルキル基;フェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕を示す。);

25 (Fda7) フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキルチオ基、フェニルC1~6アルコキシ基、ヒドロキシ基、C1~6アルキルスルフィニル基、C1~6アルキルスルホニルオキシ基、

シアノ基、C1~6アルカノイル基、ベンゾイル基、アルキル部分にC1~6アルコキシ基を有することのあるフェニルC1~6アルキル基、アミノ基、ニトロ基、カルバモイル基、C1~6アルカノイルアミノ基、C1~6アルコキシカルボニル基、C1~6アルキルアミノカルボニル基、C1~6アルコキシカルボニルアミノ基、トリC1~6アルキルシロキシ基、ピロリル基、テトラヒドロピラニルオキシ基及びイミダブリル基からなる群より選ばれた基が1~5個置換していてもよい);

(Fda8) ビフェニリルC1~6アルキル基:

(Fda9) ベンズヒドリル基 (ベンゼン環上には、ハロゲン原子、トリフルオロ 10 メチル基及びトリフルオロメトキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい);

(Fda10) フェノキシC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、 ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未 置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換 していてもよい):

(Fda11) フェニルC 2~6 アルキニル基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6 アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい);

(Fda12) ピリジルC1~6アルキル基;

(Fda13) 一般式 (Fdc) で表される基

20

15

$$N-R^{31}$$
 (Fdc)

(ここで、R³¹は、フェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未 25 置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい];フェニルC1~6アルキル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]又はベンゾイル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、 10

ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1 種が置換していてもよい]を示す。);

(Fda14) ピペリジノC1~6アルキル基 (ピペリジン環上には、フェニル環上 に置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のアルキル基を少なくとも1個有す ることのあるフェノキシ基が置換していてもよい) ;

(Fda15) アミノC1~6アルキル基(アミノ基上には、C1~6アルキル基及 びフェニル環上に置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基を有することのあるフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種 が置換していてもよい):

(Fda16) 1, 2, 3, 6ーテトラヒドロピリジルC1~6アルキル基(1, 2, 3, 6ーテトラヒドロピリジン環上には、少なくとも1個のフェニル基[フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基が少なくとも1個置換していてもよい]が置換していてもよい);

15 (Fda17) ナフチルC1~6アルキル基;

(Fda18) フルオレニルC1~6アルキル基:

(Fda19) ピリジルC1~6アルキル基;

(Fda20) フリルC1~6アルキル基(フラン環上には、ハロゲン置換もしくは 未置換のフェニル基が置換していてもよい);

20 (Fda21) チエニルC1~6アルキル基;

(Fda22) オキサゾリルC1~6アルキル基(オキサゾール環上には、ハロゲン原子又はハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基が置換していてもよい);

(Fda23) オキサジアゾリルC1~6アルキル基(オキサジアゾール環上には、 ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基が置換していてもよい);

25 (Fda24) ピラゾリルC1~6アルキル基(ピラゾール環上には、ハロゲン置換 もしくは未置換のフェニル基が置換していてもよい);

(Fda25) ベンゾチエニルC1~6Tルキル基(ベンゾチオフェン環上には、ハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6Tルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

(Fda26) チオフェン環上にハロゲン原子が置換していてもよいチエニルC1~6アルキル基:

(Fda27) ベンゾチアゾリルC1~6アルキル基;

(Fda28) ベンゾフラン環上にハロゲン原子が置換していてもよいベンゾフリル $5 C1 \sim 6$ アルキル基:

(Fda29) インドリニル $C1\sim6$ アルキル基(インドリン環上には、 $C1\sim6$ アルキル基及びオキソ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい):

(Fda30) ベンゾオキサゾリルC1~6アルキル基(ベンゾオキサール環上には、 10 ハロゲン原子、C1~6アルキル基及びオキソ基からなる群より選ばれた基の少 なくとも1種が置換していてもよい);

(Fda31) クロメニルC1~6アルキル基;

(Fda32) 1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリルC1~6アルキル基(キノリン環上には、C1~6アルキル基及びオキソ基からなる群より選ばれた基の少な 15 くとも1種が置換していてもよい);

(Fda33) チアゾリルC1~6アルキル基(チアゾール環上には、ハロゲン原子、 ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基及びC1~6アルキル基からなる群よ り選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

又は

20 (Fda34) テトラゾリルC1~6アルキル基 (テトラゾール環上には、ハロゲン 置換もしくは未置換のフェニル基及びC1~6アルキル基からなる群より選ばれ た基の少なくとも1種が置換していてもよい)

を示す。);

(Fd37) 一般式 (Fe) であらわされる基:

 $-Z - NR^{32}R^{33}$ (Fe)

(式中、Zは-C=O又は-C=Sを示す。 R^{32} 及び R^{33} は、同一又は異なって、

- (Fe1) 水素原子;
- (Fe2) C1~6アルキル基;

(Fe3) C3~8シクロアルキル基;

(Fe4) フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換して5 いてもよい);

10 又は

(Fe6) フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1 種が置換していてもよい)を示す。:

15 (Fe7) 或いは、R ^{3 2} 及びR ^{3 3} は、これらが隣接する窒素原子と共に他の炭素原子を介して互いに結合してピペリジン環又は1, 2, 3, 6ーテトラヒドロピリジン環を形成してもよい。該ピペリジン環及び1, 2, 3, 6ーテトラヒドロピリジン環上には、フェニル基が置換してもよく、該フェニル基にはハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。);

(Fd38) 一般式 (Ff) で表される基:

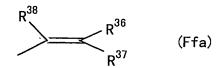
$$-N = C < \frac{R^{34}}{R^{35}}$$
 (Ff)

(式中、 R^{34} は水素原子又は $C1\sim6$ 低級アルキル基を示す。 R^{35} は、

25 (Ff1) C3~8シクロアルキル基;

(Ff2) C3~8シクロアルケニル基;

(Ff3) 一般式 (Ffa) で表される基:



(ここで、R³⁶、R³⁷及びR³⁸は、各々水素原子;C1~6アルキル基;フェニル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基、C1~4アルキレンジオキシ基、C1~6アルキルスルホニル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキルチオ基、ニトロ基及び置換基としてC1~6アルカノイル基を有することのあるアミノ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が1~5個置換していてもよい];ベンゾフリル基[ベンゾフラン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい];ビフェニリル基、フリル基[フラン環上には、置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル基が置換していてもより]又はチアゾリル基[チアゾール環上には、ハロゲン原子を有することのあるフェニル基が少なくとも1個置換していてもよい]を示す。);

(Ff4) フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子; ハロゲン置換もしくは 未置換のC1~6のアルキル基; C3~8シクロアルキル基; ヒドロキシル基; ハロゲン置換もしくは未置換のC1~8のアルコキシ基; C3~8シクロアルコ 20 キシ基; C1~4アルキレンジオキシ基; シアノ基; ニトロ基; フェニルC2~6アルケニル基; C2~6アルカノイルオキシ基; 置換基としてC1~6アルカノイル基を有することのあるアミノ基; C1~6アルキルスルホニルアミノ基; フェニルC1~6アルコキシ基; フェノキシ基; C1~6アルキル基が少なくとも1個置換したアミノ基; フェニル基が少なくとも1個置換したアミノ基; アミ 25 ノC1~6アルコキシ基 [アミノ基上には、C1~6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい]; C1~6アルコキシカルボニル基; C1~6アルコキシカルボニルC1~6アルコキシ基; C1~6アルキルチオ基; ピロリル基; イミダゾリル基; ピペリジル基; モルホリノ基; ピロリジニル基; チエニル基; ベンゾフリル基; ピペラジニル基 [ピペラジン環上には、置換基としてC1~6ア

ルキル基、フェニルC1~6アルキル基及びC1~6アルキル基を少なくとも1種看することのあるベンゾイル基からなる群より選ばれた基が少なくとも1種置換していてもよい];キノリル基[キノリン環上にC1~6アルコキシ基及びオキソ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい];ピペリジン環上にカルボスチリル基が置換していてもよいピペリジルカルボニル基及びトリアゾリル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

(Ff5) ナフチル基(ナフタレン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基及び置換基としてC1~6アルキル基を有することのあるアミノ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

(Ff6) ビフェニリル基(ビフェニリル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~9アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

(Ff7) フルオレニル基;ピレニル基;

(Ff8) ベンゾフリル基 (ベンゾフラン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換 もしくは未置換のC1~6アルキル及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよ

20 V);

10

15

(Ff9) ベンゾチエニル基 (ベンゾチオフェン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

25 (Ff10) ピリジル基(ピリジン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基、フェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基が少なくとも1種が置換していてもよい]、フリル基及びチエニル基からなる群より選ばれた基の少なく

とも1種が置換していてもよい);

(Ff11) フリル基(フラン環上には、 $C1\sim6$ のアルキル基、ニトロ基及びフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ のアルコキシ基及びニトロ基からなる群より選ばれた基が少なくとも1種が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基が $1\sim3$ 個置換していてもよい);

(Ff12) ベンゾチアゾール基 (ベンゾチアゾール環上には、置換基としてフェニル環上にC1~6のアルコキシ基を有することのあるフェニル基が少なくとも1個置換していてもよい):

- 10 (Ff13) チエニル基 (チオフェン環上には、ハロゲン原子、ニトロ基、C1~6アルキル基、ピラゾール環上にハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよいピラゾリル基及びチオフェン環上にハロゲン原子が置換していてもよいチエニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
- 15 (Ff14) インドリル基(インドール環上には、置換基としてC1~6アルキル 基を有することのあるフェニルスルホニル基、フェニルC1~6アルキル基、C 1~6アルコキシカルボニル基及びフェニル基からなる群より選ばれた基の少な くとも1種が置換していてもよい):

(Ff15) ピロリル基(ピロール環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1 20 ~6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよいフェニル基及びC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい); (Ff16) クマリル基;

(Ff17) ベンゾイミダゾリル基 (ベンゾイミダゾール環上には、少なくとも1個のチエニル基が置換していてもよい):

25 (Ff18) オキサゾリル基 (オキサゾール環上には、ハロゲン原子を有すること のあるフェニル基が少なくとも1個置換していてもよい);

(Ff19) チアゾリル基(チアゾール環上には、少なくとも1個のフェニル基が 置換していてもよい。該フェニル環上には、ハロゲン原子、ニトロ基及びフェニ ル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。); (Ff20) キノリル基;

(Ff21) 3, 4-ジヒドロカルボスチリル基(3, 4-ジヒドロカルボスチリル環上には、C1~6アルコキシ基、C1~6アルキル基及びフェニルC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)、カルボスチリル基(カルボスチリル環上には、C1~6アルコキシ基、C1~6アルキル基及びフェニルC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

(Ff22) イミダゾ [2, 1-b] チアゾリル基;

(Ff23) イミダゾ [2, 1-a] ピリジル基;

10 (Ff24) クロマニル基 (クロマン環上には、少なくとも1個の $C1\sim6$ アルキル基が置換していてもよい);

又は

(Ff25) 2, 3-ジヒドロベンゾフリル基

を示す。);

15 又は

(Fd39) 一般式 (Ffb) で表される基:

(式中、R⁴⁵は、C1~6アルコキシカルボニル基;フェニル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基[アミリなくとも1種が置換していてもよい];アミノ置換C1~6アルキル基[アミノ基上には、フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)及びC1~6アルキル基なる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい];ベンゾイル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい];フ

エニルC1~6アルキル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]:フェニルC1~6アルコキシカルボニル基[フェニル環上には、ハロゲン

原子、ハロゲン置換もしくは未置換 $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]又はフェニル $C2\sim6$ アルケニル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換 $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくと

10 も1種が置換していてもよい]を示す。)

を示す。)

F12-3) モルホリノ基:

F12-4) イミダゾリル基;

F12-5) 1, 4-ジオキサアザスピロ [4, 5] デシル基(1, 4-ジオキサア 15 ザスピロ [4, 5] デカン環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していて もよい);

F12-6) ホモピペラジニル基 (ホモピペラジン環上には、C1~6アルコキシカルボニル基、フェニルC1~6アルコキシカルボニル基及びフェニル置換もしくは未置換のフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換してい

20 てもよい):

F12-7) ピペラジニル基(ピペラジン環上には、オキソ基、 $C1\sim6$ アルキル基、フェニル $C1\sim6$ アルキル基[フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基の少なくとも1個が置換していてもよい]からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

25 F12-8) ピペリジル基 (ピペリジン環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい);

F12-9) ピロリジニル基(ピロリジン環上には、置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基を有することのあるフェノキシC1~6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい);

又は、

F12-10) イソインドリニル基

を示す。;

(F13-1) スクシンイミド基;

(F13-2) オキサゾリジニル基 (オキサゾリジン環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい);

10 (F13-3) ベンゾー1, 3ーオキサゾリジニル基 (ベンゾー1, 3ーオキサゾリジン環上には、オキソ基、ハロゲン原子及びフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

(F13-5) ベンゾイミダゾリジニル基(ベンゾイミダゾリジン環上には、オキソ基、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、置換基としてC1~6アルキル基を有することのあるアミノ基、C1~6アルコキシカルボニル基及びピペリジル基[ピペリジン環上には、C1~6アルキル基、フェニル環上にハロゲン原子が1~3個置換していてもよいフェニル基、C1~6アルコキシカルボニル基及びフェニルC1~6アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

25 (F13-6) フタルイミド基;

(F13-7) インドリニル基 (インドリン環上には、C1~6アルキル基、ハロゲン原子及びオキソ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

(F13-8) 2, 3-ジヒドロベンゾチアゾリル基(2,3-ジヒドロベンゾチア

ゾール環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい);

(F13-9) 1H-2, 4-ベンゾオキサジニル基(<math>1H-2, 4-ベンゾオキサジン環上には、少なくとも <math>1 個のオキソ基が置換していてもよい);

(F13-10) 一般式 (Fga) で表される基:

5

$$0 \longrightarrow 0 \\ \mathbb{R}^{39} \qquad (Fga)$$

(式中、R³⁹は、水素原子;フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニルC1~6アルキル基;フェニル環上に置換基としてハロゲ10 ン原子を有することのあるフェノキシC1~6アルキル基;フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニルC2~6アルケニル基;フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基及びフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよいフェニル15 基;ピリジル基又はピラジニル基を示す。)

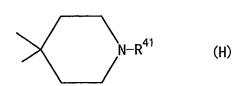
(F13-11) 1, 3-4アゾリジニル基(1, 3-4アゾリジン環上には、置換基としてオキソ基及びフェニル環上にハロゲン置換又は未置換の $C1\sim6$ アルキル基を有していてもよいフェニル $C1\sim6$ アルキリデン基からなる群より選ばれる基の少なくとも1種が置換していてもよい。)

20 一般式(G)で表される基:

$$\begin{array}{c|c}
N & N \\
N & N \\
N & N
\end{array}$$
(G)

(式中、 R^{40} は、 $C1\sim6$ アルキル基又はハロゲン置換もしくは未置換のフェ 25 ニル基を示す。)

一般式(H)で表されるスピロ環基:



(式中、R⁴¹は、

- 5 H1) 水素原子;
 - H2) C1~6アルキル基;
 - H3) フェニル環上に置換基としてフェニル基を有することのあるフェニルC1~6アルキル基:
- H4) フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置 換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基、 10 アミノ基「アミノ基上には、C1~6アルキル基及びフェニル基(フェニル環上 には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロ ゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少 なくとも1種が置換していてもよい)からなる群より選ばれた基の少なくとも1 種が置換していてもよい]、フェノキシ基[フェニル環上には、ハロゲン原子、 15 ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置 換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換し ていてもよい]及びピペリジル基[ピペリジン環上には、少なくとも1個のフェ ノキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換С1 20 ~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からな る群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)が置換していても よい]からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい); H5) ピペラジニルC1~6アルキル基 (ピペラジン環上には、C1~6アルコキ シカルボニル基及びフェニルC1~6アルコキシカルボニル基 [フェニル環上に は、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲ 25 ン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基及びフェニル基からなる群より選 ばれた基が1~3個置換していてもよい]からなる群より選ばれた基の少なくと も1種が置換していてもよい):
 - H6) ピペラジニルカルボニルC1~6アルキル基 (ピペラジン環上には、C1~

6アルコキシカルボニル基、フェニル環上に置換基としてハロゲン置換もしくは 未置換のC1~6アルキル基を有していてもよいフェニルC1~6アルコキシカ ルボニル基及びフェニルC1~6アルキル基[フェニル環上には、ハロゲン置換 もしくは未置換のC1~6アルキル基及びフェニル基からなる群より選ばれた基 の少なくとも1種が置換していてもよい]からなる群より選ばれた基の少なくと も1種が置換していてもよい);

- H7) フェニルカルバモイル $C1\sim6$ アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい);
- 10 H8) ベンゾオキサゾリルC1~6アルキル基(ベンゾオキサゾール環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい);
 - H9) ベンゾチアゾリル基;
 - H10) テトラゾリル基 (テトラゾール環上には、少なくとも 1 個のフェニル基が 置換していてもよい) ;
- 15 H11) C1~6アルキルスルホニル基;
 - H12) フェニルスルホニル基(フェニル環上には、少なくとも1個の $C1\sim6$ アルキル基が置換していてもよい);
 - H13) フェニルチオカルバモイル基 (フェニル環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい);
- 20 H14) C1~8アルコキシカルボニル基;
 - H15) フェニルC $1\sim6$ アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、C $1\sim6$ アルコキシカルボニル基、置換基としてC $1\sim6$ アルコキシカルボニル基を有していてもよいアミノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC $1\sim6$ アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC $1\sim6$ アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC $1\sim6$ アルキル基、ニトロ基及
- 25 びC1~6アルキルチオ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
 - H16) ベンズヒドリルオキシカルボニル基 (フェニル環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい) ;
 - H17) フェニル置換もしくは非置換のフェニルC1~6アルコキシカルボニル

基;

- H18) ナフチルC1~6アルコキシカルボニル基;
- H19) ピリジルC1~6アルコキシカルボニル基;
- H20) $C1\sim6$ アルコキシ置換 $C1\sim6$ アルコキシカルボニル基;
- 5 H21) ピペラジニルC1~6アルコキシカルボニル基(ピペラジン環上には、C 1~6アルコキシカルボニル基及びフェニルC1~6アルコキシカルボニル基 [フェニル環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい] か らなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
 - H22) フェノキシカルボニル基 (フェニル環上には、C1~6アルキル基及びC
- 10 $1 \sim 6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい);
 - H23) C1~6アルカノイル基;
 - H24) ベンゾイル基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい);
- 15 H25) フェニル $C1\sim6$ アルカノイル基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基が少なくとも1 個置換していてもよい); H26) フェノキシ $C1\sim6$ アルカノイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子が $1\sim3$ 個置換していてもよい);
- H27) ピペラジニルC 2~6アルカノイル基(ピペラジン環上には、C 1~6ア ルカノイル基、フェニルC 1~6アルキル基[フェニル環上には、フェニル基、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン 置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基を少なくとも1種が置換していてもよい]、フェニルC 1~6アルコキシカルボニル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6ア
- 25 ルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基を少なくとも1種が置換していてもよい]、フェニルカルバモイル $C1\sim6$ アルキル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基を少なくとも1種が置換していてもよい]、フ

エニルカルバモイル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基を少なくとも1種が置換していてもよい]及びベンゾオキサゾリル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

- H28) フェニルカルバモイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、置換基として $C1\sim6$ アルキル基を有することのあるアミノ基、カルボキシル基、 $C1\sim6$ アルコキシカルボニル基、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキシ基、ピペラジン環上に置換基として $C1\sim6$ アルキル基を有することのあるピペラジニル基及びモルホリノ基からなる群より選ばれた基が $1\sim3$ 個置換していてもよい);
- H29) フェニルC1~6アルキルカルバモイル基(フェニル環上には、ハロゲン 置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していて

15 もよい);

10

又は

H30) ピペラジニルカルボニル基 (ピペラジン環上には、C1~6アルコキシカルボニル基、フェニルC1~6アルコキシカルボニル基 [フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい] 及びフェニルC1~6アルキル基 [フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい] からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) を示す。)

但し、 R^1 が水素原子を示し、 R^2 が一般式(A)で表される基を示す場合、 R^3 はイソプロピル基であってはならない。また、 R^1 が水素原子を示し、 R^2 が一般式(E)で表される基を示し、 M^3 0を示す場合、 R^{11} は水素原子であってはならない。更に、 R^1 が水素原子を示し、 R^2 が一般式(E)で表される基を示す場合、 R^1 が水素原子を示し、 R^2 が一般式(E)で表される基を示す場合、 R^{19} は水素原子を示し且つ R^{20} がtertーブトキシカルボニル基を示してはならない。 E^1 0。

さらに、本発明は、一般式(1')

$$O_2N$$

$$(CH_2)_nR^2$$

$$(1')$$

で表される2, 3-ジヒドロー6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾー

5 ル化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩:

(式中、 R^1 は水素原子又は $C1\sim6$ アルキル基を示す。nは $0\sim6$ の整数を示す。 R^2 は下記一般式(A')、(B')、(C')、(D')、(E')、(E')、(E'))、(E'))、(E'))、(E'))、(E

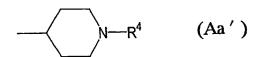
10 (H')で表されるスピロ環を形成していてもよい。)を提供する。 以下に、一般式(A')~(H')について説明する。

一般式(A')で表される基;

$$-OR^3$$
 (A')

(式中、R³は

- 15 A1) 水素原子;
 - A2) C1~6アルキル基;
 - A3) C1~6アルコキシ-C1~6アルキル基;
 - A4) フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ベンジルオキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換
- 20 のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい):
 - A5) ビフェニリルC1~6アルキル基:
 - A6) シンナミル基:
 - A7) メタンスルホニル基;
- 25 A8) メチル基が置換していてもよいベンゼンスルホニル基:
 - A9) C1~6アルカノイル基;
 - A10) 一般式 (A a') で表される基;



(ここでR⁴は、C1~6アルコキシカルボニル基;フェニルC1~6アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ベンジルオキシ基、ハロゲン置換もしくは 5 未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)又はフェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ベンジルオキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していて 10 もよい)を示す。)

- A11) ビフェニリルC1~6アルコキシカルボニル基;
- A12) 2- (2-オキソ-3-ベンゾオキサゾリル) エチル基;
- A13) 2-ベンゾオキサゾリル基;
- A14) 2-フェニル-5-メチル-4-オキサゾリルメチル基;
- 15 一般式(B')で表される基;

$$-SR5$$
 (B')

(式中、 R^5 は、5-(1H) ーテトラゾリル基(1位が $C1\sim6$ アルキル基又はハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基で置換していてもよい)又は2-ベンゾオキサゾリル基を示す)、

20 一般式 (C') で表される基;

$$-COOR^6$$
 (C')

(式中、 R^6 は $C1\sim6$ アルキル基を示す。)

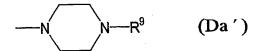
一般式 (D') で表されるカルバモイルオキシ基;

$$-OOCNR^7R^8$$
 (D')

- 25 (式中、 R^7 及び R^8 は、同一又は異なって、
 - D1) 水素原子;
 - D2) C1~8アルキル基;
 - D3) ハロゲン置換C1~6アルキル基;
 - D4) C1~6アルコキシカルボニルC1~6アルキル基;

もよい);

- D5) C5~8シクロアルキル基;
- D6) フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン 置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していて
- D7) フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基、C1~6アルカノイル基、カルボキシル基、C1~6アルコキシカルボニル基、ベンジルオキシカルボニル基、カルバモイル基、C1~6アルキルカルバモイル基、アミノスルホニル基及びモルホリノ基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい);
 - D8) 1-ナフチル基;
 - D9) 4-ピリジル基;
- D10) R^7 及び R^8 は、隣接するN原子と共に、他のヘテロ原子もしくは炭素原 子を介し又は介することなく互いに結合して下記(D10-1)~(D10-3)に示す飽和複 素環基又は下記(D10-4)~(D10-7)に示すベンゼン縮合複素環基を形成していても よい。
 - (D10-1) 一般式 (Da') で示されるピペラジニル基;



20

5

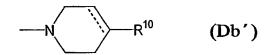
(ここでR⁹は

- (Da1) 水素原子;
- (Da2) C1~6アルキル基;
- (Da3) フェニルC $1\sim6$ アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲ25 ン置換もしくは未置換のC $1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC $1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい);
 - (Da4) フェニル基 (フェニル環上にハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基

からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい):

- (Da5) C1~6アルコキシカルボニル基;
- (Da6) フェニルC1~6アルコキシカルボニル基(フェニル環上にハロゲン原子、 ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未
- 5 置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換 していてもよい);
 - (Da7) 4-トリフルオロメチルシンナミルオキシカルボニル基:又は
 - (Da8) 4-トリフルオロメチルベンジリデンアミノ基を示す。)
 - (D10-2) 一般式 (Db') で示される基;

10



(式中、点線は二重結合であってもよいことを示す。 R 10 は

- (Db1) 水素原子;
- 15 (Db2) フェニル基 (フェニル環上にハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい):
 - (Db3) フェノキシ基(フェニル環上にハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基の少なくとも1種が置換していてもよい);又は
- 20 (Db4) フェニルアミノ基 (フェニル環上にハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基の少なくとも1種が置換していてもよい)を示す。)
 - (D10-3) モルホリノ基;
 - (D10-4) ハロゲン置換もしくは未置換の1-インドリニル基;
 - (D10-5) ハロゲン置換もしくは未置換の2-イソインドリニル基:
- 25 (D10-6) ハロゲン置換もしくは未置換の1, 2, 3, 4ーテトラヒドロー1ーキ ノリニル基;
 - (D10-7) ハロゲン置換もしくは未置換の1, 2, 3, 4ーテトラヒドロー2ーイ ソキノリニル基を示す。)
 - 一般式 (E') で表されるフェノキシ基:

(式中、Xはハロゲン原子を示す。mは0~3の整数を示す。 R^{11} は

- 5 E1) 水素原子;
 - E2) ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基;
 - E3) ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基;
 - E4) モルホリノ基;
 - E5) チオモルホリノ基;
- 10 E6) S-オキシドチオモルホリノ基;
 - E7) 1-イミダゾリル基;
 - E8) 1-トリアゾリル基;
 - E9) 一般式 (E a') で示されるピペリジニル基:

15

(式中、R¹²は

- (Eal) 水素原子;
- (Ea2) C1~6アルコキシカルボニル基;又は
- 20 (Ea3) フェノキシ基(フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン 置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1 種が置換していてもよい)を示す。)
 - E10) 一般式 (E b') で表される基:

25

$$-(C=O)_k$$
 $N-R^{15}$ (Eb')

(式中、kは0又は1を示す。 R^{15} は

- (Eb1) 水素原子;
- (Eb2) C1~6アルキル基;

- (Eb3) フェニル $C1\sim6$ アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
- 5 (Eb4) フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換 もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~ 6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよ い);
 - (Eb5) C1~6アルカノイル基;
- 10 (Eb6) フェニルC 2~6T アルカノイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6T アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6T アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
- (Eb7) ベンゾイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは 未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコ キシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい); (Eb8) C1~8のアルコキシカルボニル基 (アルコキシ基上には、ハロゲン原子、 ジ (C1~6アルキル) アミノ基及びC1~6アルコキシ基からなる群より選ば れた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
- 20 (Eb9) フェニル $C1\sim6$ アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
 - (Eb10) フェニルC3~6アルケニルオキシカルボニル基(フェニル環上には、
- 25 ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン 置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なく とも1種が置換していてもよい);
 - (Eb11) フェノキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン 置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC

1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

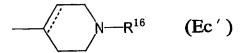
(Eb12) フェニル $C1\sim6$ アルキルカルバモイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

(Eb13) フェニルカルバモイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン 置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していて

10 もよい);又は

(Eb14) ベンゼン環上にハロゲン原子が置換していてもよい2-ベンゾフラニル メチルオキシカルボニル基を示す。)

E11) 一般式 (E c') で表される基:



15

5

(式中、点線は二重結合であってもよいことを示す。 R 16 は

- (Ec1) 水素原子;
- (Ec2) C1~6アルキル基;
- (Ec3) フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロ20 ゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
 - (Ec4) C1~8のアルコキシカルボニル基;又は
- (Ec5) フェニルC1~6アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲ 25 ン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1 種が置換していてもよい)を示す。)

一般式 (F') で表される基:

$$-NR^{19}R^{20}$$
 (F')

[式中、R¹⁹及びR²⁰は、同一又は異なって

F1) 水素原子;

15

- F2) C1~6アルキル基;
- F3) フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン 置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1 ~6アルコキシ基及びジメチルアミノ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1種が置換していてもよい);
- F4) フェノキシC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン ン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の 10 C1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換してい てもよい);
 - F5) NーメチルアミノC1~6アルキル基(N位には、C1~6アルコキシカルボニル基或いはフェニル環上にハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよいフェニル基が置換してもよい);
 - F6) フェニル基(フェニル環上にハロゲン原子及びC1~6アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
 - F7) C1~6アルコキシカルボニル基;
- F8) フェニル $C1\sim6$ アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原 20 子、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
 - F9) 一般式 (Fa') で表される4-置換-1-ピペラジニルエチル基;

$$-CH_2CH_2 N - R^{21}$$
 (Fa')

(ここで、 R^{21} は $C1\sim6$ アルコキシカルボニル基、フェニル $C1\sim6$ アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$

6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)、フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)又はフェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)を示す。

F10) 一般式 (Fb') で表される1-置換-4-ピペリジニル基;

10

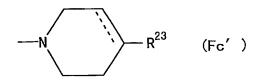
(ここで R^{22} は、 $C1\sim6$ アルコキシカルボニル基;フェニル $C1\sim6$ アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキン基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);又はフェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)を示す。)、又は

F11) 2- [4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) -1-ピペリジニル] , 20 エチル基を示す。

F12)更に、 R^{19} 及び R^{20} は、これらが隣接する窒素原子と共に他のヘテロ原子もしくは炭素原子を介しもしくは介することなく互いに結合して下記F12-1)~F12-10)に示す複素環を形成していてもよい。

F12-1) 一般式 (F c') で表される基

25



(ここで点線は二重結合であってもよいことを示す。 R 23 は

(Fc1) C1~6アルキル基;

25

- (Fc2) フェニルC $1\sim6$ アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC $1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC $1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい);
- 5 (Fc3) フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは 未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコ キシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
 - (Fc4) フェニルC1~6アルコキシ基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置
- 10 換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
 - (Fc5) 4-ビフェニリルC1~6アルコキシ基;
 - (Fc6) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェニルC3~6アルケニルオキシ基;
- 15 (Fc7) フェノキシ基(フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン 置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していて もよい);
- (Fc8) ベンゾイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしく 20 は未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい); (Fc9) $C1\sim6$ アルコキシカルボニル基:
 - (Fc10) フェニル $C1\sim6$ アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基の少なくとも1種が置換していてもよい);
 - (Fc11) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェニルC1~6 アルキルカルバモイル基:
 - (Fc12) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェニルカルバモイル基;

- (Fc13) フェニルチオ基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換の C1~6アルコキシ基の少なくとも1種が置換していてもよい):
- (Fc14) フェニルスルホキシド基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは 未置換のC1~6アルコキシ基の少なくとも1種が置換していてもよい):
- 5 (Fc15) ピリジルメトキシ基;又は
 - (Fc16) 式 (Fca') で表される基:

 $-NR^{24}R^{25}$ (Fca')

[式中、R²⁴及びR²⁵は、各々

(Fcal) 水素原子;

- 10 (Fca2) C1~6アルキル基;
 - (Fca3) フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
- 15 (Fca4) フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン 置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していて もよい);
 - (Fca5) C1~6アルカノイル基:
- 20 (Fca6) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェニルアセチル 基;
 - (Fca7) ベンゾイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよ
- 25 (i);
 - (Fca8) C1~6アルコキシカルボニル基:
 - (Fca9) フェニルC1~6アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも

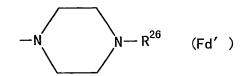
1種が置換していてもよい);

(Fcal0) フェニルカルバモイル基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは 未置換の $C1\sim6$ アルキル基の少なくとも1 種が置換していてもよい);又は (Fcal1) 1-(4-トリフルオロメチルフェニル)-4-ピペリジニルオキシ カルボニル基を示す。

(Fcal2) R 24 及びR 25 は、隣接する窒素を介してピペリジン環を形成してもよい。)を示す。]

F12-2) 一般式 (F d') で表される4-置換-1-ピペラジニル基;

10



(式中、R²⁶は

- (Fd1) 水素原子;
- (Fd2) C1~6アルキル基;
- 15 (Fd3) C5~8シクロアルキル基;
 - (Fd4) C5~8シクロアルキル-C1~6アルキル基;
 - (Fd5) C1~6アルコキシカルボニル-C1~6アルキル基;
 - (Fd6) シンナミル基;
- (Fd7) フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子;シアノ 20 基;ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基;シクロヘキシル基;ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基;ジメチルアミノ基;C1~6アルコキシカルボニル基;フェノキシ基;フェニルC1~6アルキル基;スチリル基;3ーピリジル基;1ーイミダゾリル基及び1ーピペリジノ基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい);
- 25 (Fd8) ビフェニリルメチル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換 もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6 アルコキシ基及びジメチルアミノ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種 が置換していてもよい);
 - (Fd9) 1-又は2-ナフチルメチル基:

(Fd10) フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ジメチルアミノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基、C1~6アルコキシカルボニル基及びカルボキシル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよ

5 い);

(Fd11) ビフェニリル基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

(Fd12) アミノ基、C1~6アルコキシカルボニル基が置換したアミノ基、ベン ジルアミノ基、トリフルオロメチルベンジルアミノ基又はフェニルアミノ基 (フェニル環上にはハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン 原子からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい); (Fd13) 4-クロロベンゾイルメチル基、

(Fd14) フェニルカルバモイルメチル基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もし

15 くは未置換のC1~6アルキル基の少なくとも1種が置換していてもよい); (Fd15) 4-又は5-チアゾリルメチル基(チアゾール環上には、ハロゲン置換 もしくは未置換のフェニル基及びC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基 の少なくとも1種が置換していてもよい);

(Fd16) 4-オキサゾリルメチル基(オキサゾール環上には、ハロゲン置換もし 20 くは未置換のフェニル基及びC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

(Fd17) 2-インドリルメチル基;

(Fd18) 2-フリルメチル基(フラン環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基の少なくとも1種が置換していてもよい);

25 (Fd19) 4-又は5-イミダゾリルメチル基 (イミダゾール環上には、フェニル 基が置換していてもよい);

(Fd20) 2-キノリルメチル基;

(Fd21) 5-(1H) ーテトラブリル基 (テトラブール環の1位には、フェニル基が置換していてもよい);

- (Fd22) フェニル基が置換していてもよい2-又は4-ピリミジル基;
- (Fd23) 2-、3-又は4-ピリジル基;
- (Fd24) 2 ーベンゾオキサゾリル基;
- (Fd25) 2 ーベンゾチアゾリル基;
- 5 (Fd26) 2-オキソー3-ベンゾオキサゾリル-C1~6アルキル基;
 - (Fd27) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェノキシC2~6 アルカノイル基;
 - (Fd28) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェニルチオC2~6アルカノイル基;
- 10 (Fd29) フェニルC2~6アルカノイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、 ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未 置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換 していてもよい);
 - (Fd30) ベンゾイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしく
- 15 は未置換の $C1\sim6$ アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基及び $C1\sim6$ アルキルアミノ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
 - (Fd31) 4 ビフェニリルカルボニル基;
 - (Fd32) 2-、3-、又は4-ピリジルカルボニル基:
- 20 (Fd33) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいシンナモイル基;
 - (Fd34) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェニルC1~6アルキルスルホニル基;
 - (Fd35) ベンゼンスルホニル基 (ベンゼン環上には、塩素原子及びメチル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
- 25 (Fd36) 一般式 (Fda') で表される基:

$$-COOR^{27}$$
 (Fda')

(式中R²⁷は

- (Fda1) ハロゲン置換もしくは未置換のC1~8のアルキル基;
- (Fda2) C5~8シクロアルキル基:

10

15

20

- (Fda3) C5~8シクロアルキル-C1~6アルキル基;
- (Fda4) C1~6アルコキシ-C1~6アルキル基;
- (Fda5) C1~6アルキルアミノ-C1~6アルキル基:
- (Fda6) 一般式 (Fdb') で表される基

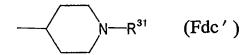
(ここで R^{28} 、 R^{29} 及び R^{30} は、各々水素原子; $C1\sim6$ アルキル基;フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)を示す。)、

(Fda7) フェニルC $1 \sim 6$ アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC $1 \sim 6$ アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC $1 \sim 6$ アルコキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC $1 \sim 6$ アルコキン基、ハロゲン置換もしくは未置換のC $1 \sim 6$ アルキルチオ基、フェニルC $1 \sim 6$ アルコキシ基、ヒドロキシ基、メチルスルフィニル基、メタンスルホニル基、メタンスルホニルオキシ基、シアノ基、アセチル基、ベンゾイル基、 α 、 α ージメトキシベンジル基、アミノ基、ニトロ基、カルバモイル基、アセチルアミノ基、C $1 \sim 6$ アルコキシカルボニル基、C $1 \sim 6$ アルキルアミノカルボニル基、C $1 \sim 6$ アルコキシカルボニルアミノ基、トリC $1 \sim 6$ アルキルシロキシ基、ピロリル基、テトラヒドロピラニルオキシ基及び1 ーイミダゾリル基からなる群より選ばれた基が $1 \sim 5$ 個置換していてもよい);

- (Fda8) ビフェニリルC1~6アルキル基:
- (Fda9) ベンズヒドリル基 (ベンゼン環上には、ハロゲン原子、トリフルオロメチル基及びトリフルオロメトキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
- 25 (Fda10) フェノキシC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、 ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未 置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換 していてもよい):
 - (Fda11) 3- (4-トリフルオロメチル)フェニルー2-プロピニル基:

(Fda12) 2-、3-、又は4-ピリジルメチル基:

(Fda13) 一般式 ((Fdc') で表される基



- 5 (ここでR³¹は、フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);又はベンゾイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル其及びハロゲン開始ましく
 - が置換していてもよい); 又はベンゾイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)を示す。)、
- 15 (Fdal4) 1-ピペリジノエチル基 (ピペリジン環の4位に4-トリフルオロメ チルフェノキシ基が置換していてもよい) :

(Fda15) N-メチル-N- (4-トリフルオロメトキシ) フェニルアミノエチル基;

(Fda16) 4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1,2,3,6-テト 20 ラヒドロ-1-ピリジニルエチル基:

(Fda17) 1-又は2-ナフチルメチル基;

(Fda18) 1-、2-、3-、4-、又は9-フルオレニルメチル基;

(Fda19) 2-、3-、又は4-ピリジルメチル基;

(Fda20) 2-フリルメチル基(フラン環の4位にハロゲン置換もしくは未置換 25 のフェニル基が置換していてもよい);

(Fda21) 3-チエニルメチル基:

(Fda22) 4-オキサゾリルメチル基(オキサゾリン環の2位にハロゲン原子又はクロロフェニル基が置換していてもよい);

(Fda23) ハロゲン原子が置換していてもよい4-チアゾリルメチル基;

(Fda24) 5-オキサジアゾリルメチル基(オキサジアゾリン環の2位にハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基が置換していてもよい);

(Fda25) 3-ピラゾリルメチル基(ピラゾリン環の1位にハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基が置換していてもよい);

5 (Fda26) 2-又は3-ベンゾチオフェニルメチル基(ハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種がベンゼン環上に置換していてもよい);

(Fda27) ベンゼン環上にハロゲン原子が置換していてもよいベンゾオキサゾー ル-2-イルメチル基:

10 (Fda28) ハロゲン原子が置換していてもよい2-チエニルメチル基;

(Fda29) 2-ベンゾチアゾリルメチル基;

(Fda30) 2-(5-クロロ) ベンゾフラニルメチル基;

(Fda31) 3, $3-ジメチルー2-オキソー5-インドリニルメチル基 (インドリン環の1位に<math>C1\sim6$ アルキル基が置換していてもよい);

15 (Fda32) 2-オキソー6-ベンゾオキサゾリルメチル基(ベンゾオキサゾリン 環の1位に $C1\sim6$ アルキル基が置換していてもよい);

(Fda33) 7ークロメニルメチル基;

(Fda34) 2-オキソー1, 2, 3, $4-テトラヒドロー6ーキノリルメチル基 (キノリン環の1位に<math>C1\sim6$ アルキル基が置換していてもよい);

20 (Fda35) 5- チアゾリルメチル基(チアゾール環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基及びC $1\sim6$ アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);又は

(Fda36) 5-(1H) ーテトラゾリルC $1\sim6$ アルキル基(テトラゾール環の 1 位にハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基及びC $1\sim6$ アルキル基からな る群より選ばれた基が置換していてもよい)を示す。)

(Fd37) 一般式 (Fe') で表される基:

25

$$-Z - NR^{32}R^{33}$$
 (Fe')

(式中、Zは-C=O又は-C=Sを示す。R 32 及びR 33 は、同一又は異なって

- (Fe1) 水素原子;
- (Fe2) C1~6アルキル基:
- (Fe3) C5~8シクロアルキル基;
- (Fe4) フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロ
 5 ゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換
 のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換して
 いてもよい);
- (Fe5) フェニルC 2~6 アルケニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置 換のC 1~6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) : 又は
 - (Fe6) フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは 未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコ キシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)を示 す。
- (Fe7) 或いは、R³²及びR³³は、隣接する窒素原子と共に他の炭素原子を介して互いに結合してピペリジン環又は1,2,3,6ーテトラヒドロピリジン環を形成してもよい。該ピペリジン環及び1,2,3,6ーテトラヒドロピリジン環の4位には、フェニル基が置換してもよく、該フェニル基にはハロゲン原子20 及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。)を示す。)

(Fd38) 一般式 (Ff') で表される基:

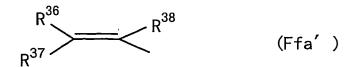
$$- N = C < R^{34}$$
 (Ff')

25

15

(式中、 R^{34} は水素原子又は $C1\sim6$ 低級アルキル基を示す。 R^{35} は

- (Ff1) C5~8シクロアルキル基;
- (Ff2) C5~8シクロアルケニル基:
- (Ff3) 一般式 (Ffa') で表される基:



(ここで、R³⁶、R³⁷及びR³⁸は、各々水素原子; C1~6アルキル基; フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基、メチレンジオキシ基、メタンスルホニル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキルチオ基、ニトロ基及びアセチルアミノ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が1~5個置換していてもよい); 2 -ベンゾフラニル基(ベンゼン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい); 4 - ビフェニリル基; 4 - クロロフェニル基が置換していてもよい2 - フリル基; 又は2 - (4 - クロロフェニル) - 4 - チアゾリル基を示す。)

15 (Ff4) フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子: ハロゲン置換もしくは未 置換のC1~6アルキル基:C5~8シクロアルキル基;ヒドロキシ基;ハロゲ ン置換もしくは未置換のC1~8のアルコキシ基;C5~8シクロアルコキシ 基;メチレンジオキシ基;エチレンジオキシ基;シアノ基;ニトロ基;シンナミ ル基;C1~6アルカノイルオキシ基;C1~6アルカノイルアミノ基;メタン 20 スルホニルアミノ基;フェニルC1~6アルコキシ基;フェノキシ基;ジ(C1 ~6アルキル) アミノ基;ジフェニルアミノ基;ジ(C1~6アルキル) アミノ C1~6アルコキシ基;メトキシカルボニル基; C1~6アルコキシカルボニル C1~6アルコキシ基; C1~6アルキルチオ基; ピロリル基; 1-イミダゾリ ル基:ピペリジノ基;モルホリノ基;ピロリジニル基;2-チエニル基:2-ベ ンゾフラニル基:1位がC1~6アルキル基、フェニルC1~6アルキル基、ベ 25 ンゾイル基及びC1~6アルキル基置換ベンゾイル基からなる群より選ばれた基 で置換していてもよい4ーピペラジニル基:ベンゼン環上にC1~6アルコキシ 基が置換していてもよい2ーオキソー3ーキノリル基:4ー(カルボスチリルー 1ーイル) ピペリジニルー1ーカルボニル基及びトリアゾリル基からなる群より

15

選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

- (Ff5) ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基又はジメチルアミノ基が置換した1-又は2-ナフチル基;
- (Ff6) 3-又は4-ビフェニリル基(ビフェニル環上には、ハロゲン原子、ハロ ゲン置換もしくは未置換のC1~9アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
 - (Ff7) 2-フルオレニル基;3-ピレニル基;
- (Ff8) 2 ーベンゾフラニル基 (ベンゼン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換 10 もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
 - (Ff9) $2-又は3-ベンゾチオフェニル基(ベンゼン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の<math>C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1 種が置換
 - していてもよく、チオフェン環の3位又は2位がC1~6アルキル基で置換していてもよい);
- (Ff10) 2、3、又は4ーピリジル基(これらのピリジル基上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、フェニル基(フェニル
 環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた
 - 基が $1\sim2$ 個置換していてもよい)、2-フリル基、3-フリル基、2-チェニル基及び3-チェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。);
- 25 (Ff11) 2 又は3 ーフリル基(これらフラン環上には、 $C1\sim6$ のアルキル基、 ニトロ基及びフェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もし くは未置換の $C1\sim6$ アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基及びニトロ基からなる群より選ばれた基が $1\sim3$ 個置換していてもよい)からなる群より選ばれた基が $1\sim3$ 個置換していてもよい);

- (Ff12) 2 (2-メトキシフェニル) ベンゾチアゾール-5-イル基:
- (Ff13) 2ーチエニル基;3ーチエニル基;4ーブロモー2ーチエニル基;5ークロロー2ーチエニル基;5ーエチルー2ーチエニル基;3ーメチルー2ーチエニル基;5ー(1ーメチルー3ートリフルオロメ
- 5 チルー5ーピラブリル)ー2ーチエニル基;5ー(1ーメチルー5ートリフルオロメチルー3ーピラブリル)ー2ーチエニル基;2,2'ービチエンー5ーイル基;5'ープロモー2,2'ービチエンー5ーイル基、
 - (Ff14) 1 (4-メチルベンゼンスルホニル) インドール-3-イル基;1-ベンジルインドール-3-イル基;6-メトキシカルボニルインドール-3-イ
- 10 ル基;2ーフェニルインドールー3ーイル基;
 - (Ff15) 1-(3-トリフルオロメチル)フェニル-2, 5-ジメチル-3-ピロリル基;
 - (Ff16) 6 クマリル基;
 - (Ff17) 2 (2-チェニル) 5 ベンゾイミダゾリル基; 6 ベンゾイミダ
- 15 ゾリル基;
 - (Ff18) 2- (4-クロロフェニル) 4-オキサゾリル基;
 - (Ff19) 2-フェニルー4-チアゾリル基;2-(4-クロロフェニル)-4-チアゾリル基;2-(4-ニトロフェニル)-4-チアゾリル基;2-(4-ビフェニリル)-4-チアゾリル基;
- 20 (Ff20) 2-チアゾリル基;
 - (Ff21) 2-又は4-キノリニル基:
 - (Ff22) 8-メトキシー3, 4-ジヒドロカルボスチリルー5-イル基;8-メトキシー1-メチルー3, 4-ジヒドロカルボスチリルー5-イル基;8-ベンジルオキシー3, 4-ジヒドロカルボスチリルー5-イル基;8-メトキシカル
- 25 ボスチリル-5-イル基;8-メトキシ-1-メチルカルボスチリル-5-イル 基;8-ベンジルオキシカルボスチリル-5-イル基;8-メトキシ-3,4-ジヒドロカルボスチリル-6-イル基;8-メトキシ-1-メチル-3,4-ジ ヒドロカルボスチリル-6-イル基;8-ベンジルオキシ-3,4-ジヒドロカ ルボスチリル-6-イル基;8-メトキシカルボスチリル-6-イル基;8-メ

トキシー1-メチルカルボスチリル-6-イル基;8-ベンジルオキシカルボス チリル-6-イル基;

- (Ff23) 6-イミダゾ [2, 1-b] チアゾリル基:
- (Ff24) 2-イミダゾ [2, 1-a] ピリジル基:
- 5 (Ff25) 2, 2-ジメチル-6-クロマニル基: 又は
 - (Ff26) 2, 3-ジヒドロ-5-ベンゾフラニル基を示す。)
 - F12-3) モルホリノ基;
 - F12-4) 1-イミダゾリル基:
 - F12-5) 1, 4-ジオキサ-8-アザスピロ[4,5]-8-デシル基:
- 10 F12-6) 4-tert-ブトキシカルボニル-1-ホモピペラジニル基; 4-ベンジルオキシカルボニル-1-ホモピペラジニル基; 4-(4-ビフェニリル)-1-ホモピペラジニル基、
 - F12-7) 1 tert ブチルー 2 ピペラジノンー 4 イル基; 1 (4 トリフルオロメチルベンジル) 2 ピペラジノン— 4 イル基;
- 15 F12-8) 4 オキソー1 ピペリジニル基:
 - F12-9) 2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシメチル) ピロリジン-1-イル基;
 - F12-10) 2-イソインドリニル基:
 - F13) 更に、 R^{19} 及び R^{20} は、隣接する窒素原子と共にヘテロ原子を介しもしくは介することなく互いに結合して、下記F13-1)~F13-11)に示す環状イミド又
 - はアミドを形成していてもよい。

20

- F13-1) 2-スクシンイミド基;
- F13-2) 2ーオキソオキサゾリン-3ーイル基;
- F13-3) 2ーオキソベンゾー1, 3ーオキサゾリジン-3-イル基;5-ブロモ
- 25 -2-オキソベンゾー1, 3-オキサゾリジン-3-イル基; 5-クロロ-2-オキソベンゾー1, 3-オキサゾリジン-3-イル基; 5-フェニル-2-オキソベンゾー1. 3-オキサゾリジン-3-イル基:
 - F13-4) 2ーオキソイミダゾリジンー1ーイル基(2ーオキソイミダゾリジンー1ーイル基の3位には、フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロ

ゲン原子及びメトキシ基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい) 又はフェニル基が置換していてもよい):

F13-5) 2ーオキソベンゾイミダゾリジン-1ーイル基(ベンゼン環上にハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ジメチルアミノ基 又はエトキシカルボニル基が置換していてもよく、イミダゾリジン環の3位には C1~6アルキル基;ハロゲン原子が1~3個置換していてもよいフェニル基; tert-ブトキシカルボニル基及びベンジルオキシカルボニル基からなる群より選ばれた基が置換してもよい4ーピペリジニル基が置換していてもよい);

F13-6) フタルイミド-2-イル基:

10 F13-7) 3位にメチル基又はフッ素原子が2個置換したオキシインドールー1ー イル基;

F13-8) ベンゾイックスルフィミド-2-イル基:

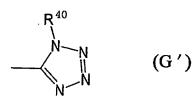
F13-9) 1 H-2, 4-ベンゾオキサジン-3 (4 H) -オン-4-イル基; F13-10) 一般式 (Fga') で表される基:

$$0 \longrightarrow 0 \qquad \qquad (Fga')$$

(式中、R³⁹は、水素原子;ハロゲン置換もしくは未置換のフェニルC1~6 アルキル基;ハロゲン置換もしくは未置換のフェノキシメチル基;ハロゲン置換 20 もしくは未置換のスチリル基;ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基から なる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよいフェニル基;ビフ ェニリル基;4-ピリジル基又は2-ピラジニル基を示す。)

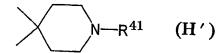
F13-11) 5 - (4-トリフルオロメチルベンジリデン) - 1, 3-チアゾリジ 25 ン-2、4-ジオン-3-イル基;

一般式(G')で表される基;



(式中、 R^{40} は、 $C1\sim6$ アルキル基又はハロゲン置換もしくは未置換のフェ 5 ニル基を示す。)

一般式(H')で表されるスピロ環基;



(式中、R⁴¹は、

- 10 H1) 水素原子;
 - H2) C1~6アルキル基;
 - H3) フェニルC1~6アルキル基又は4-ビフェニリルC1~6アルキル基;
 - H4) フェニル基(ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基が置換していてもよい);
- H5) 4ー置換-1ーピペラジニルC1~6アルキル基(4位の置換基がC1~6アルコキシカルボニル基、4ービフェニリルメトキシカルボニル基又はベンジルオキシカルボニル基であり、該ベンジルオキシカルボニル基はベンゼン環上にハロゲン、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~3個置20 換していてもよい)
 - H6) 4位がC1~6アルコキシカルボニル、4ートリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル、4ートリフルオロメチルベンジル基又はビフェニリルメチル基で置換された4ー置換-1-ピペラジニルカルボニルC1~6アルキル基;
 - H7) 4-トリフルオロメチルフェニルカルバモイルC1~6アルキル基;
- 25 H8) 2-ベンゾオキサゾロン-1-イルプロピル基;
 - H9) 2-ベンゾチアゾリル基:
 - H10) 1-フェニルー5-テトラゾリル基:
 - H11) メタンスルホニル基;
 - H12) ベンゼンスルホニル又はp-トルエンスルホニル基;

- H13) フェニル環の4位にハロゲン原子が置換していてもよいフェニルチオカルバモイル基;
- H14) $C1\sim8$ のアルコキシカルボニル基;
- H15) フェニルC1~6アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン
- 5 原子、C1~6アルコキシカルボニル基、C1~6アルコキシカルボニルアミノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基、ニトロ基及びメチルチオ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい):
 - H16) ベンズヒドリルオキシカルボニル基(フェニル環上にハロゲン原子が 1 ~
- 10 4個置換していてもよい);
 - H17) 4-ビフェニリルメトキシカルボニル基:
 - H18) ナフチルメトキシカルボニル基;
 - H19) ピリジルメトキシカルボニル基;
 - H20) メトキシエトキシカルボニル基:
- 15 H21) 4位に $C1\sim6$ アルコキシカルボニル基又はハロゲン置換もしくは未置換のフェニル $C1\sim6$ アルコキシカルボニル基が置換していてもよい2-(1-1) ペラジニル)エトキシカルボニル基;
 - H22) フェノキシカルボニル基(フェニル環上には、 $C1\sim6$ アルキル基及び $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1 種が置換していて
- 20 もよい);
 - H23) C1~6アルカノイル基;
 - H24) ベンゾイル基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基の少なくとも1種が置換していてもよい);
 - H25) フェニルC2~6アルカノイル基(フェニル環上には、ハロゲン置換もし
- 25 くは未置換の $C1\sim6$ アルキル基の少なくとも1 種が置換していてもよい)、
 - H26) フェノキシC 2 \sim 6 γ アルカノイル基(フェニル環上にハロゲン原子が 1 \sim 3 個置換していてもよい);
 - H27) 4-置換-1-ピペラジニルC $2\sim6$ アルカノイル基(4位の置換基がC $1\sim6$ アルカノイル基、フェニルC $1\sim6$ アルカノイル基、フェニルC $1\sim6$ アルキル基、4-ビフェニリルメチル

基、フェニルC1~6アルコキシカルボニル基、フェニルカルバモイルメチル基、フェニルカルバモイル基又は2-ベンゾオキサゾリル基であり、該フェニルC1~6アルキル基、フェニルC1~6アルコキシカルボニル基、フェニルカルバモイルメチル基及びフェニルカルバモイル基の各フェニル環上にはハロゲン、ハロケン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい)

H28) フェニルカルバモイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ジメチルアミノ基、カルボキシル基、 $C1\sim6$ アルコキシカルボニル基、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基、4-メチルー1-ピペラジニル基及びモルホリノ基からなる群より選ばれた基が $1\sim3$ 個置換していてもよい):

H29) ベンジルカルバモイル基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ

15 基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);又は H30) 4位にtertーブトキシカルボニル基、4ートリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基又は4ートリフルオロメチルベンジル基で置換された4ー置換ー1-ピペラジニルカルボニル基を示す。

但し、上記式(1)の化合物において R^1 が水素原子を示し、 R^2 が一般式 (A') で表される基を示す場合、 R^3 はイソプロピル基であってはならない。また、 R^1 が水素原子を示し、 R^2 が一般式(E')で表される基を示し、mが 0を示す場合、 R^{11} は水素原子であってはならない。更に、 R^1 が水素原子を示し、 R^2 が一般式(F')で表される基を示す場合、 R^{19} は水素原子を示し 且つ R^2 0 がtert-ブトキシカルボニル基を示してはならない。

25 本発明は、上記式(1)において、 R^2 が一般式(A)である 2, 3-ジェドロ-6-ニトロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

本発明は、上記式(1)において、R 2 が一般式(B)である 2 0、3 2 0 2 1 2 1 2 2 2 2 2 3 2 4 2 5 2 6 2 7 2 7 2 8 2 8 2 8 2 9 2

体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

本発明は、上記式(1)において、 R^2 が一般式(C)である 2 、 3-ジヒド u-6-ニトロイミダゾ [2 、 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性 体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

5 本発明は、上記式(1)において、R²が一般式(D)である2,3ージヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

本発明は、上記式(1)において、 R^2 が一般式(E)である2、3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

本発明は、上記式(1)において、 R^2 が一般式(F)である 2 、3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2 、1- b 】 オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

本発明は、上記式(1)において、 R^2 が一般式(G)である2、3-ジヒド 15 ロ-6-ニトロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性 体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

本発明は、上記式(1)において、nが1~6であり、 R^2 が一般式(A)から(G)のいずれかであるか又は R^1 及びー(CH_2) $_n$ R^2 が隣接する炭素原子と共に窒素原子を介して互いに結合して形成する一般式(H)で表されるスピ

ロ環である2,3-ジヒドロー6-ニトロイミダブ[2,1-b]オキサゾール 化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

本発明は、上記式(1)において、 R^1 が水素原子であり、 R^2 が一般式 (A)から(G)のいずれかであるか又は R^1 及びー(CH_2) $_n$ R^2 が隣接する炭素原子と共に窒素原子を介して互いに結合して形成する一般式(H)で表されるスピロ環である2、3-ジヒドロー6-ニトロイミダゾ [2、1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

15 本発明は、上記式(1)において、 R^2 が一般式(E)であり、 R^{11} が(E 1)~(E3)である2、3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

本発明は、上記式(1)において、 R^2 が一般式(E)であり、 R^{11} が(E20 4)である 2、3 ージヒドロー 6 ーニトロイミダゾ [2, 1 ー b] オキサゾール 化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。 本発明は、上記式(1)において、 R^2 が一般式(E)であり、 R^{11} が(E5)~(E9)である 2、3 ージヒドロー 6 ーニトロイミダゾ [2, 1 ー b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。

25 本発明は、上記式(1)において、 R^2 が一般式(E)であり、 R^{11} が(E10)である2,3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。本発明は、上記式(1)において、 R^2 が一般式(E)であり、 R^{11} が(E11)である2,3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2,1-b] オキサゾー

ル化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。本発明は、上記式(1)において、 R^2 が一般式(E)であり、 R^{11} が(E12)である 2,3-ジェドロー <math>6 ーニトロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

5 本発明は、上記式 (1) において、 R^2 が一般式 (E) であり、 R^{11} が (E 13) である 2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

本発明は、上記式(1)において、 R^2 が一般式(E)であり、 R^{11} が(E14)~(E17)及び(E19)~(E22)である特許請求の範囲第7項記 載の2,3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。

本発明は、上記式(1)において、 R^2 が一般式(E)であり、 R^{11} が(E18)である 2 、 3 ージヒドロー 6 ーニトロイミダゾ [2 、 1 ー b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

本発明は、上記式(1)において、 R^2 が一般式(F)であり、 R^{19} 及び R^{20} が、同一又は異なって(F1)~(F11)である2,3-ジヒドロ-6 -ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又は それらの薬理学的に許容される塩を提供する。

本発明は、上記式(1)において、 R^2 が一般式(F)であり、 R^{19} 及び R^{20} が、隣接する窒素原子と共に他のヘテロ原子もしくは炭素原子を介しもし くは介することなく形成する複素環が(F12-3)~(F12-10)又は (F13) である 2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ <math>[2, 1-b] オキサ ゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供 する。

25 本発明は、上記式 (1) において、 R^2 が一般式 (F) であり、 R^{19} 及び R^{20} が、隣接する窒素原子と共に他のヘテロ原子もしくは炭素原子を介しもし くは介することなく形成する複素環が (F12-1) である 2 、3-ジヒドロー 6-ニトロイミダゾ [2 、1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又 はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

25

本発明は、上記式(1)において、 R^2 が一般式(F)であり、 R^{19} 及び R^{20} が、隣接する窒素原子と共に他のヘテロ原子もしくは炭素原子を介しもし くは介することなく形成する複素環が(F12-2)である2, 3-ジヒドロー 6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又 はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

本発明は、上記式(1)において、 R^2 が一般式(E)であり、 R^{11} が(E10)であり、oが0である2,3-ジヒドロー6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

10 本発明は、上記式(1)において、 R^2 が一般式(E)であり、 R^{11} が(E 10)であり、oが1でWが基-CO-である2、3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2、1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

本発明は、上記式(1)において、 R^2 が一般式(E)であり、 R^{11} が(E 15 10)であり、oが1でWがC1~o7ルキレン基である2、o3ージヒドローo6 ーニトロイミダゾ[2、1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

本発明は、上記式 (1) において、 R^2 が一般式 (E) であり、 R^{11} が (E 10) であり、 R^{14} が (E a a 1) ~ (E a a 2)、又は (E a a 4) ~ (E a a 27) である 2, 3 ージヒドロー 6 ーニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

本発明は、上記式(1)において、 R^2 が一般式(E)であり、 R^{11} が(E 10)であり、 R^{14} が(E a a 3)である 2,3 — ジヒドロー 6 — ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。

本発明は、上記式(1)において、 R^2 が一般式(E)であり、 R^{11} が(E 11)であり、oが0である2、3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2、1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容され

10

る塩を提供する。

本発明は、上記式(1)において、 R^2 が一般式(E)であり、 R^{11} が(E11)であり、Oが1である2、O0・ジヒドロO1 ー O0・プロング (O1 において、O2 が一般式(O2 が一般式(O2 が)にあり、O3 が O4 において、O5 が O5 が O6 において、O7 が O8 において、O8 が O9 が O9

本発明は、上記式(1)において、 R^2 が一般式(F)であり、 R^{19} 及び R^{20} が、隣接する窒素原子と共に他のヘテロ原子もしくは炭素原子を介しもしくは介することなく形成する複素環が(F12-2)であり、 R^{26} が(Fd1)~(Fd35)、(Fd37)又は(Fd39)である2,3-ジヒドロー6-ニトロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

本発明は、上記式(1)において、 R^2 が一般式(F)であり、 R^{19} 及び R^{20} が、隣接する窒素原子と共に他のヘテロ原子もしくは炭素原子を介しもしくは介することなく形成する複素環が(F12-2)であり、 R^{26} が(Fd3

15 6) である 2, 3 - ジヒドロー 6 - ニトロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール 化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

本発明は、上記式(1)において、 R^2 が一般式(F)であり、 R^{19} 及び R^{20} が、隣接する窒素原子と共に他のヘテロ原子もしくは炭素原子を介しもしくは介することなく形成する複素環が(F12-2)であり、 R^{26} が(Fd3

20 8) である 2, 3 - ジヒドロ - 6 - ニトロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール 化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

本発明は、上記式(1)において、 R^2 が一般式(F)であり、 R^{19} 及び R^{20} が、隣接する窒素原子と共に他のヘテロ原子もしくは炭素原子を介しもしくは介することなく形成する複素環が(F12-2)であり、 R^{26} が(Fd3

25 6) であり、 R^{27} が(Fda1)~(Fda5)又は(Fda7)~(Fda34)である2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

本発明は、上記式(1)において、 R^2 が一般式(F)であり、 R^{19} 及び R^{20} が、隣接する窒素原子と共に他のヘテロ原子もしくは炭素原子を介しもし

くは介することなく形成する複素環が(F 1 2 - 2)であり、R 26 が(F d 3 6)であり、R 27 が(F d a 6)である 2 ,3 - ジヒドロ- 6 - - トロイミダ ゾ [2 ,1 - b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学 的に許容される塩を提供する。

- 本発明は、上記式(1)において、 R^2 が一般式(F)であり、 R^{19} 及び R^{20} が、隣接する窒素原子と共に他のヘテロ原子もしくは炭素原子を介しもしくは介することなく形成する複素環が(F12-2)であり、 R^{26} が(Fd38)であり、 R^{35} が(Ff11)~(Ff31)、(Ff51)~(Ff71)又は(Ff91)~(Ff261)である2、3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2、
- 10 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

本発明は、上記式(1)において、 R^2 が一般式(F)であり、 R^{19} 及び R^{20} が、隣接する窒素原子と共に他のヘテロ原子もしくは炭素原子を介しもしくは介することなく形成する複素環が(F12-2)であり、 R^{26} が(Fd3

15 8) であり、 R^{35} が(Ff4)である2、3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的 に許容される塩を提供する。

本発明は、上記式(1)において、 R^2 が一般式(F)であり、 R^{19} 及び R^{20} が、隣接する窒素原子と共に他のヘテロ原子もしくは炭素原子を介しもし 20 くは介することなく形成する複素環が(F12-2)であり、 R^{26} が(Fd38)であり、 R^{35} が(Ff8)である2,3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的 に許容される塩を提供する。

本発明の式(1)又は式(1')で表わされる化合物のうち、特に好ましい化 25 合物として、下記の化合物が挙げられる。

4-(2-メチル-6-ニトロ-2、3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸 3-(4-トリフルオロメチルフェニル) -2-プロペニルエステル、

(S) - 4- (2-メチル-6-ニトロ-2、3-ジヒドロイミダブ [2, 1-

- b] オキサゾールー2ーイルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸 3ー(4ート リフルオロメチルフェニル) -2-プロペニルエステル、
- (R) 4 (2 メチル 6 ニトロ 2、3 ジヒドロイミダゾ <math>[2, 1 b] オキサゾール 2 イルメチル) ピペラジン 1 カルボン酸 3 (4 ト)
- 5 リフルオロメチルフェニル) -2-プロペニルエステル、
 - 2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-$ [4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェノキシメチル $\}$ -2、3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b] オキサゾール、
- (S) -2-メチル-6 -ニトロ-2- $\{4-$ [4-(4-トリフルオロメトキ 10 シフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェノキシメチル $\}$ -2, 3-ジヒドロ イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、
- 15 2-メチルー6-ニトロー2ー {4-[1-(4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペリジンー4-イル] フェノキシメチル} -2、3-ジヒドロイミダゾ [2、1-b] オキサゾール、

 - 6-ニトロ-2- {4- [4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリ
- 25 ジン-1-イル] フェノキシメチル} -2、3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、
 - (S) -6-ニトロ-2- $\{4-$ [4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェノキシメチル $\}$ -2 、3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

- 2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-[3-(4-$ トリフルオロメトキシフェノ 5 キシ) -8-アザビシクロ [3. 2. 1] オクタン-8-イル] フェノキシメチル $\}-2$ 、3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、
 - (S) -2-メチル-6-ニトロ-2- {4-[3-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) -8-アザビシクロ[3.2.1] オクタン-8-イル] フェノキシメチル} -2、3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b] オキサゾール、
- 10 (R) -2-メチル-6-ニトロ-2- {4-[3-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) -8-アザビシクロ[3.2.1] オクタン-8-イル] フェノキシメチル} -2、3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b] オキサゾール、
 - (R) -2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-[3-(4-$ トリフルオロメトキシフェノキシ) -8-アザビシクロ [3. 2. 1] オクタン-8-イル] フェノ
- 15 キシメチル} 2、3 ジヒドロイミダゾ [2, 1 b] オキサゾール 4 トルエンスルホン酸塩、
 - 2-メチル-6-ニトロ-2- [4-(4-トリフルオロメチルベンジリデンアミノ)ピペラジン-1-イル]-2、3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、
- 20 (S) -2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(4-トリフルオロメチルベンジリデンアミノ) ピペラジン-1-イル] -2、3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b] オキサゾール、
- 25 b] オキサゾール、
 - $2-[4-(5-\rho uu^{-1}u^{1$
 - (S) -2-[4-(5-0) 2-1] (5-0) (5

ラジン-1-イル] -2-メチル-6-ニトロ-2、3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

- 5 1-b]オキサゾール、

20

- 2-[4-(5-h)] フルオロメチルベングフランー2-d ルメチレンアミノ) ピペラジンー1-dル] -2-d チルー6-h -2 、3-i に ドロイミダグ [2, 1-b] オキサゾール、
- (S) -2-[4-(5-)リフルオロメチルベンゾフラン-2-イルメチレン 10 アミノ) ピペラジン-1-イル] -2-メチル-6-ニトロ-2、3-ジヒドロ イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、
 - (R) 2 [4 (5 h)] フルオロメチルベンゾフラン- 2 l ルメチレンアミノ)ピペラジン- 1 l ル] 2 l チル- 6 l トロ- 2 、 3 l ドロイミダゾ [2, 1 b] オキサゾール、
- 15 2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-$ [4-(4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル $\}-2$, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b] オキサゾール、
 - (S) -2-x チル-6 ーニトロ-2 ー $\{4-[4-(4-トリフルオロメチル ベンジル) ピペラジン<math>-1$ ーイル] フェノキシメチル $\}$ ー 2 , 3 ージヒドロイミ ダゾ [2 , 1 ー b] オキサゾール、

 - 2ーメチルー6ーニトロー2ー {4ー [4ー (4ートリフルオロメトキシベンジ
- 25 ル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル $\}$ -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、
 - (S) -2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-$ [4-(4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル $\}-2$, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

2-メチルー6-ニトロー2-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピ 5 ペリジン-1-イルメチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサ ゾール、

- (S) $-2-\lambda + \nu 6-\lambda 2-\lambda 2-\lambda$
- (R) -2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イルメチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール、

2-[4-(4-h)] フルオロメトキシフェニル)ピペラジン-1-h ル] -2-x チル-6-h ニトロ-2 、3-y ピドロイミダゾ [2 、1-b] オキ サゾール、

- (S) -2-[4-(4-h)] フルオロメトキシフェニル) ピペラジン-1-イルメチル] -2- メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、
- (R) -2-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン-1-イ
 20 ルメチル] -2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

- [2, 1-b] オキサゾール、
- (S) -2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(4'-トリフルオロメチルビフェニル-4-イルメチル)ピペラジン-1-イルメチル] -2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b] オキサゾール、
- 5 (R) -2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(4'-トリフルオロメチルビフェニル-4-イルメチル)ピペラジン-1-イルメチル] -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-$ [4- (4-トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル $\}-2$, 3-ジヒドロイミダゾ

- 10 [2, 1-b] オキサゾール、
 - (S) -2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-$ [4-(4-トリフルオロメチル フェニル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル $\}$ -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、
- (R) -2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-[4-(4-$ トリフルオロメチル 15 フェニル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル $\}$ -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-$ [4- (4-クロロベンジル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル $\}$ -2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b] オキサゾール、

- 20 (S) -2-メチルー6-ニトロー2- $\{4$ [4- (4-クロロベンジル)ピペラジン-1-イル]フェノキシメチル $\}$ 2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1- b] オキサゾール、
 - $(R) 2 メチル 6 ニトロ 2 \{4 [4 (4 クロロベンジル) ピペラジン 1 イル] フェノキシメチル<math>\} 2$, 3 ジヒドロイミダゾ [2, 1]
- 25 b] オキサゾール、

(S) -2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (4-クロロフェニル) ピ

ペラジン-1-イル] フェノキシメチル $\}$ -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

- (R) -2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-$ [4- (4-クロロフェニル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル $\}$ -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1 5 b] オキサゾール、
 - 2-メチルー6-ニトロー2- $\{4-$ [4-(4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル) ピペラジンー1-イル] フェノキシメチル $\}$ 2 , 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b] オキサゾール、
- (S) -2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-$ [4-(4-トリフルオロメトキ 10 シベンジルオキシカルボニル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル $\}-2$, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、
- 15 2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-$ [4-(3, 4-ジクロロベンジルオキシカルボニル)ピペラジン-1-イル]フェノキシメチル $\}-2$, 3-ジヒドロイミダブ[2, 1-b]オキサゾール、
- (S) -2-メチルー6-ニトロ-2- {4- [4- (3, 4-ジクロロベンジルオキシカルボニル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジセドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

2-メチルー6-ニトロー2-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)

- 25 ピペリジン-1-イルメチル] -2, 3-ジヒドロイミダブ [2, 1-b] オキサゾール、
 - (S) -2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)ピペリジン-1-イルメチル] -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル) ピペ 5 ラジン-1-イルメチル] -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

- (S) -2-メチル-6-ニトロ-2- [4-(4-トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン-1-イルメチル] -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、
- 10 (R) -2-メチル-6-ニトロ-2- [4-(4-トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン-1-イルメチル] -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(5-トリフルオロメトキシベンゾフラン-2イルメチレンアミノ) ピペラジン-1-イルメチル] -2, 3-ジヒドロイ

- 15 ミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、
- (R) -2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(5-トリフルオロメトキシベン 20 ゾフラン-2イルメチレンアミノ) ピペラジン-1-イルメチル] -2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b] オキサゾール、

2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(5-トリフルオロメチルベンゾフランー 2イルメチレンアミノ)ピペラジン-1-イルメチル]-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b] オキサゾール、

- 25 (S) -2-x チルー6- ニトロー2-[4-(5- トリフルオロメチルベンゾフラン-2 イルメチレンアミノ)ピペラジン-1- イルメチル] -2, 3- ジヒドロイミダゾ[2, 1-b] オキサゾール、

ドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

2-メチルー6-ニトロー2- $\{4-$ [4- (4-クロロフェノキシ) ピペリジンー1-イル] フェノキシメチル $\}-2$, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

- 5 (S) -2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-$ [4- (4-クロロフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェノキシメチル $\}$ -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、
 - (R) -2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-$ [4-(4-クロロフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェノキシメチル $\}-2$, 3-ジヒドロイミダゾ [2,
- 10 1-b] オキサゾール、

2-メチル-6-ニト-2- $\{4-$ [4- (4-トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェノキシメチル $\}$ -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

- (S) $-2-\lambda + \nu 6 \mu 2 \{4 [4 (4 \mu) \nu + \mu \nu + \mu]\}$
- 15 フェノキシ) ピペリジンー1ーイル] フェノキシメチル $\}$ -2, 3 ジヒドロイ ミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、
- 20 2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-[1-(4-$ クロロベンジル) ピペリジン -4-イル] フェノキシメチル $\}$ -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、
 - (S) -2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-[1-(4-$ クロロベンジル) ピペリジン-4-イル] フェノキシメチル $\}$ -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1
- 25 b] オキサゾール、又は

本発明は、式(1)又は式(1')で表される2,3-シヒドロ-6-ニトロ

イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの 薬理学的に許容される塩を有効成分として含有する、抗結核剤である医薬組成物 を提供する。特に、本発明は、上記に列挙した好ましい化合物である2, 3-ジ ヒドロー6ーニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物から選ばれる少 なくとも1つの化合物を有効成分として含有する、抗結核剤である医薬組成物を 本発明は提供する。

本発明は、一般式 (1 a) で表される化合物の製造方法であって

$$R^1$$
 O_2N
 N
 O_2N
 O_2N
 O_3N
 O_4N
 O_4N

10

(式中、 R^1 、 R^2 及びnは請求項1において定義したものと同じである。)、

一般式(2)で表される4-ニトロイミダゾール化合物

$$0_2$$
N X_1 X_1 X_2

15

(式中、X₁はハロゲン原子又はニトロ基を示す。)と、

一般式 (3 a) で表されるエポキシ化合物

20

$$0 \xrightarrow{R^1} (CH_2)_n R^2$$
(3a)

(式中、 R^1 、 R^2 及びnは請求項1において定義したものと同じである。)と 25 を反応させて、一般式(4a)で表される化合物

(式中、 R^1 、 R^2 及びn は請求項1 において定義したものであり、 X_1 はハロゲン原子又はニトロ基を示す。)を得、次いで得られた一般式(4a)で表される化合物を閉環させることにより製造する、当該製造方法を提供する。

また、本発明は、一般式(1b)で表される化合物の製造方法であって

10

$$0_2N$$
 R^1
 CH_2R^{2a}
 $(1b)$

(式中、 R^1 は請求項1において定義したものと同じであり、 R^2 は請求項1 15 において定義した一般式(A)、(B)、(E)又は(F)で表される基を示す。)、

一般式(3b)で表される化合物

$$0_2N$$
 N
 X_1
 $(3b)$

20

(式中、 R^1 は請求項1において定義したものと同じであり、 X_1 はハロゲン原子又はニトロ基を示す。)と、一般式(5)で表される化合物 R^{2a} H(5)又 はその塩(R^{2a} は、請求項1において定義した一般式(A)、(B)、(E)又は(F)で表される基を示す。)とを反応させて、一般式(A b)で表される化合物

 $(R^1$ は請求項1において定義したものと同じであり、 R^2 は請求項1において定義した一般式 (A)、(B)、(E) 又は (F) で表される基を示し、 X^1 はハロゲン原子又はニトロ基を示す。)を得、次いで一般式 $(4\ b)$ で表される 化合物を閉環させることにより製造する、当該製造方法を提供する。

さらに、本発明は、一般式(1 c)で表される化合物の製造方法であって

$$0_2$$
N (1c)

15

(式中、 R^{41} は請求項1において定義したものと同じである。)、 一般式 (2) で表される化合物

20

$$0_2$$
N X_1 X_2 X_2

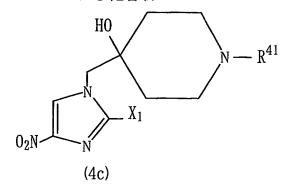
(式中、 X_1 はハロゲン原子又はニトロ基を示す。)と、一般式(3c)で表さ 25 れる化合物

$$0 \qquad N - R^{41}$$
(3c)

20

25

(式中、R 41 は請求項1において定義したものと同じである。)とを反応させて、一般式(4c)で表される化合物



(式中、 $\mathbf{R}^{4\,1}$ は請求項 $\mathbf{1}$ において定義したものと同じであり、 $\mathbf{X}_{\mathbf{1}}$ はハロゲン 10 原子又はニトロ基を示す。)を得、次いで得られた一般式($\mathbf{4}_{\mathbf{c}}$)で表される化 合物を閉環させることにより製造する、当該製造方法を提供する。

発明を実施するための形態

本明細書において、 R^1 、 R^2 、 R^3 等で示される各基は、具体的に次の通りである。

15 ハロゲン原子としては、例えば、フッ素原子、塩素原子、臭素原子及びョウ素 原子を示す。

C1~6アルキル基とは、炭素原子が1ないし6から構成される直鎖状又は分 岐鎖状のアルキル基であって、例えば、メチル基、エチル基、nープロピル基, イソプロピル基、nーブチル基、イソブチル基、tertーブチル基、secー ブチル基、nーペンチル基、ネオペンチル基、nーヘキシル基、イソヘキシル基、 3ーメチルペンチル基等を挙げることができる。

C1~6アルキレン基としては、例えば、メチレン、エチレン、トリメチレン、 2-メチルトリメチレン、2, 2-ジメチルトリメチレン、1-メチルトリメチ レン、メチルメチレン、エチルメチレン、テトラメチレン、ペンタメチレン、ヘ キサメチレン基等を挙げることができる。

 $C1\sim6$ アルコキシ基とは、上記定義された $C1\sim6$ アルキル基と酸素原子で構成される基であって、例えば、メトキシ基、エトキシ基、n-プロポキシ基、イソプロポキシ基、n-ブトキシ基、イソブトキシ基、n-ブトキシ基、n-ベントキシ基、n-ベントキシ基、n-ベントキシ基、n-ベントキシ基、n-

シ基、イソヘキシルオキシ基、3ーメチルペントキシ基等を挙げることができる。 C1~6アルコキシーC1~6アルキル基とは、上記C1~6アルキル基とC 1~6アルコキシ基で構成される基であって、例えば、メトキシメチル基、メト キシエチル基、3ーメトキシプロピル基、4ーメトキシブチル基、5ーメトキシ ペンチル基、6ーメトキシヘキシル基、エトキシメチル基、2ーエトキシエチル 基、3ーエトキシプロピル基、2ーイソプロポキシエチル基、tertーブトキ シメチル基、2ー(tertーブトキシ)エチル基、3ー(tertーブトキ シ)プロピル基、6ー(tertーブトキシ)へキシル基、4ー(tertーブ トキシ)ブチル基等を挙げることができる。

- ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基とは、上記定義された炭素 10 原子が1ないし6から構成される直鎖状又は分岐鎖状のアルキル基及びハロゲン 原子が1~7個置換した前記アルキル基であって、例えば、メチル基、エチル基、 n-プロピル基、イソプロピル基、n-ブチル基、イソブチル基、tert-ブ チル基、secーブチル基、nーペンチル基、ネオペンチル基、nーヘキシル基、 イソヘキシル基、3-メチルペンチル基、フルオロメチル基、ジフルオロメチル 15 基、トリフルオロメチル基、クロロメチル基、ジクロロメチル基、トリクロロメ チル基、ブロモメチル基、ジブロモメチル基、ジクロロフルオロメチル基、2. 2. 2-トリフルオロエチル基、ペンタフルオロエチル基、2-クロロエチル基、 3,3,3-トリフルオロプロピル基、ヘプタフルオロプロピル基、ヘプタフル オロイソプロピル基、3ークロロプロピル基、2ークロロプロピル基、3ーブロ 20モプロピル基、4, 4, 4ートリフルオロブチル基、4, 4, 4, 3, 3ーペン タフルオロブチル基、4-クロロブチル基、4-ブロモブチル基、2-クロロブ チル基、5,5,5ートリフルオロペンチル基、5ークロロペンチル基、6,6, 6-トリフルオロヘキシル基、6-クロロヘキシル基等を挙げることができる。
- 25 ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基とは、上記で定義された $C1\sim6$ のアルコキシ基及びハロゲン原子が $1\sim7$ 個置換した前記アルコキシ基 であって、例えば、メトキシ基、エトキシ基、n-プロポキシ基,イソプロポキシ基、n-ブトキシ基、イソブトキシ基、n-ブトキシ基、n-ブトキシ基、n-

キシルオキシ基、3-メチルペントキシ基、フルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、クロロメトキシ基、ジクロロメトキシ基、シクロロフルオロメトキシ基、ブロモメトキシ基、ジブロモメトキシ基、ジクロロフルオロメトキシ基、2,2,2-トリフルオロエトキシ基、ペンタフルオロエトキシ基、2-クロロエトキシ基、3,3,3-トリフルオロプロポキシ基、ヘプタフルオロプロポキシ基、ヘプタフルオロイソプロポキシ基、3-クロロプロポキシ基、2-クロロプロポキシ基、3-ブロモプロポキシ基、4,4,4-トリフルオロブトキシ基、4,4,4,3,3-ペンタフルオロブトキシ基、4-クロロブトキシ基、4-ブロモブトキシ基、2-クロロブトキシ基、5,5,5-トリフルオロペントキシ基、5-クロロペントキシ基、6,6,6-トリフルオロヘキシルオキシ基、6-クロロヘキシルオキシ基等を挙げることができる。

フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、フェニルC1~6アルコキ シ基:ハロゲン置換もしくは未置換のС1~6アルキル基;ハロゲン置換もしく は未置換のC1~6アルコキシ基及びフェノキシ基[フェニル環上には、ハロゲ ン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基が少なくとも1個置換していても 15 よい]からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)とし ては、例えば、ベンジル基、1-フェネチル基、2-フェネチル基、3-フェニ ルプロピル基、2-フェニルプロピル基、4-フェニルブチル基、5-フェニル ペンチル基、4-フェニルペンチル基、6-フェニルヘキシル基、2-ベンジル オキシベンジル基、3-ベンジルオキシベンジル基、4-ベンジルオキシベンジ 20 ル基、2,4-ジベンジルオキシベンジル基、2,4,6-トリベンジルオキシ ベンジル基、2-(2-フェネチルオキシ)ベンジル基、3-(2-フェネチル オキシ)ベンジル基、4-(2-フェネチルオキシ)ベンジル基、2-(3-フ ェニルプロポキシ)ベンジル基、3-(3-フェニルプロポキシ)ベンジル基、 4-(3-フェニルプロポキシ)ベンジル基、2-(4-フェニルブトキシ)ベ 25 ンジル基、3-(4-フェニルブトキシ) ベンジル基、4-(4-フェニルブト キシ) ベンジル基、2-(5-フェニルペンチルオキシ) ベンジル基、3-(5 -フェニルペンチルオキシ)ベンジル基、4-(5-フェニルペンチルオキシ)

ベンジル基、2-(6-フェニルヘキシルオキシ)ベンジル基、3-(6-フェ

ニルヘキシルオキシ) ベンジル基、4-(6-フェニルヘキシルオキシ) ベンジ ル基、2-メチルベンジル基、2、3-ジメチルベンジル基、3、4-ジメチル ベンジル基、3,5-ジメチルベンジル基、2,6-ジメチルベンジル基、2, 4-ジメチルベンジル基、2,5-ジメチルベンジル基、2,4,6-トリメチ ルベンジル基、3,5-ジトリフルオロメチルベンジル基、2,4,6-トリフ ルオロメチルベンジル基、2-トリフルオロメチルベンジル基、3-トリフルオ ロメチルベンジル基、4ートリフルオロメチルベンジル基、2ートリフルオロメ トキシベンジル基、3-トリフルオロメトキシベンジル基、4-トリフルオロメ トキシベンジル基、3-メトキシベンジル基、2,3-ジメトキシベンジル基、 3, 4-ジメトキシベンジル基、3, 5-ジメトキシベンジル基、2, 6-ジメ 10 トキシベンジル基、2,4-ジメトキシベンジル基、2,5-ジメトキシベンジ ル基、2,4,6-トリメトキシベンジル基、2,6-ジトリフルオロメトキシ ベンジル基、2、3、4-トリフルオロメトキシベンジル基、1-(4-ベンジ ルオキシフェニル)エチル基、1-(3-ベンジルオキシフェニル)エチル基、 1- (2-ベンジルオキシフェニル) エチル基、1-(2-トリフルオロメチル 15 フェニル) エチル基、1-(3-トリフルオロメチルフェニル) エチル基、1-(4-トリフルオロメチルフェニル) エチル基、1-(2-トリフルオロメトキ シフェニル) エチル基、1-(3-トリフルオロメトキシフェニル) エチル基、 1- (4-トリフルオロメトキシフェニル) エチル基、2- (4-ベンジルオキ シフェニル) エチル基、2-(3-ベンジルオキシフェニル) エチル基、2-(2-ベンジルオキシフェニル) エチル基、2-(2-トリフルオロメチルフェ ニル) エチル基、2-(3-トリフルオロメチルフェニル) エチル基、2-(4 ートリフルオロメチルフェニル) エチル基、2-(2-トリフルオロメトキシフ ェニル) エチル基、2-(3-トリフルオロメトキシフェニル) エチル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニル) エチル基、3-(4-ベンジルオキシフ 25 ェニル)プロピル基、3-(3-ベンジルオキシフェニル)プロピル基、3-(2-ベンジルオキシフェニル)プロピル基、3-(2-トリフルオロメチルフ ェニル)プロピル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3

- (4-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(2-トリフルオロメ

トキシフェニル)プロピル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェニル)プロ ピル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)プロピル基、4-(3-ト リフルオロメチルフェニル)ブチル基、5-(4-トリフルオロメチルフェニ ル)ペンチル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ペンチル基、6-(3-トリフルオロメ 5 チルフェニル) ヘキシル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル) ヘキシル 基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル)へキシル基、2-フェノキシベ ンジル基、3-フェノキシベンジル基、4-フェノキシベンジル基、2,5-ジ フェノキシベンジル基、2,4,6-トリフェノキシベンジル基、1-(4-フ エノキシフェニル) エチル基、1-(3-フェノキシフェニル) エチル基、1-10 (2-フェノキシフェニル) エチル基、3-(4-フェノキシフェニル) プロピ ル基、3-(3-フェノキシフェニル)プロピル基、3-(2-フェノキシフェ ニル)プロピル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)ベンジル基、 3- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ベンジル基、4- (4-トリフル オロメトキシフェノキシ) ベンジル基、1-(4-(4-トリフルオロメトキシ 15 フェノキシ)フェニル)エチル基、1-(3-(4-トリフルオロメトキシフェ ノキシ)フェニル)エチル基、1-(2-(4-トリフルオロメトキシフェノキ シ)フェニル)エチル基、3-(4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) フェニル)プロピル基、3-(3-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)フ ェニル)プロピル基、3-(2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェ 20 ニル)プロピル基、2-トリフルオロメチル-3-トリフルオロメトキシベンジ ル基、2-ベンジルオキシ-3-トリフルオロメトキシベンジル基、3-フェノ キシー4-トリフルオロメチルベンジル基等のフェニルC1~6アルキル基(フ エニル環上には、フェニルC1~6アルコキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換 のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基及 25 びフェノキシ基 [フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6ア ルコキシ基が1~3個置換していてもよい]からなる群より選ばれた基が1~3 個置換していてもよい)を挙げることができる。

ビフェニリルC1~6アルキル基としては、例えば、2-ビフェニリルメチル

基、2-(2-ビフェニリル) エチル基、3-(2-ビフェニリル) プロピル基、4-(2-ビフェニリル) ブチル基、5-(2-ビフェニリル) ペンチル基、6-(2-ビフェニリル) ペンチル基、3-ビフェニリルメチル基、2-(3-ビフェニリル) エチル基、3-(3-ビフェニリル) プロピル基、4-(3-ビフェニリル) エチル基、5-(3-ビフェニリル) ペンチル基、6-(3-ビフェニリル) ペンチル基、6-(3-ビフェニリル) ペンチル基、4-(4-ビフェニリル) エチル基、3-(4-ビフェニリル) プロピル基、4-(4-ビフェニリル) ブチル基、5-(4-ビフェニリル) ペンチル基、6-(4-ビフェニリル) ブチル基、5-(4-ビフェニリル) ペンチル基、6-(4-ビフェニリル) ヘキシル基等のフェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、フェニルC1~6アルコキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基及びフェニル環上に置換基としてハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルコキシ基を少なくとも1種有することのあるフェノキシ基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい) 等を挙げることができる。

15 フェニルC 2~6アルケニル基とは、フェニル基と炭素数 2 から6で二重結合を1~3個有するアルケニル基から構成される基を意味し、フェニルC 2~6アルケニル基は、トランス体及びシス体の両者を包含する。このようなフェニルC 2~6アルケニル基としては、例えば、3ーフェニルー2ープロペニル基(慣用名:シンナミル基)、4ーフェニルー2ーブテニル基、4ーフェニルー3ーブテ20 ニル基、5ーフェニルー4ーペンテニル基、5ーフェニルー3ーペンテニル基、6ーフェニルー5ーへキセニル基、6ーフェニル)ー4ーへキセニル基、6ーフェニルー3ーへキセニル基、6ーフェニルー1、3、5ーへキサトリエニル基等を挙げることができる。

C1~6アルキルスルホニル基とは、炭素数1ないしは6個で構成されるアル 25 キル基とスルホニル基で構成される基であって、例えば、メタンスルホニル基、エタンスルホニル基、プロパンスルホニル基、ブタンスルホニル基、ペンタンス ルホニル基、ヘキサンスルホニル基等を挙げることができる。

C1~6アルキル基が置換していてもよいベンゼンスルホニル基としては、例 えば、ベンゼンスルホニル基、o-トルエンスルホニル基、m-トルエンスルホ

ニル基、pートルエンスルホニル基、2ーエチルベンゼンスルホニル基、3ーエチルベンゼンスルホニル基、4ーエチルベンゼンスルホニル基、2ープロピルベンゼンスルホニル基、4ープロピルベンゼンスルホニル基、4ープロピルベンゼンスルホニル基、2,4ージメチルベンゼンスルホニル基、2,4ージメチルベンゼンスルホニル基、2,4,6ートリメチルベンゼンスルホニル基等のC1~6アルキル基が1~3個置換していてもよいベンゼンスルホニル基を挙げることができる。

C1~6アルカノイル基としては、炭素原子数1~6で構成される脂肪族カルボン酸から誘導される基であって、例えば、ホルミル基、アセチル基、プロピオニル基、ブチリル基、ペンタノイル基、ヘキサノイル基等が挙げられる。

C1~6アルコキシカルボニル基とは、上記で定義されたC1~6アルコキシ 基とカルボニル基で構成された基であって、例えば、メトキシカルボニル基、エ トキシカルボニル基、プロポキシカルボニル基、イソプロポキシカルボニル基、 n-ブトキシカルボニル基、イソブトキシカルボニル基、tert-ブトキシカ ルボニル基、secーブトキシカルボニル基、nーペントキシカルボニル基、ネ 15 オペントキシカルボニル基、nーヘキシルオキシカルボニル基、イソヘキシルオ キシカルボニル基、3-メチルペントキシカルボニル基等を挙げることができる。 フェニルC1~6アルコキシカルボニル基「フェニル環上には、フェニルC1 ~ 6 アルコキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~ 6 アルキル基及びハロ ゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少 20なくとも1種が置換していてもよい]とは、上で定義したフェニル環上にフェニ ルC1~6アルコキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及 びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた 基が1~3個置換していてもよいフェニルC1~6アルコキシ基とカルボニル基 25で構成される基であって、例えば、ベンジルオキシカルボニル基、1-フェニル エトキシカルボニル基、2-フェニルエトキシカルボニル基、3-フェニルプロ ポキシカルボニル基、2-フェニルプロポキシカルボニル基、4-フェニルブト キシカルボニル基、5-フェニルペントキシカルボニル基、4-フェニルペント

キシカルボニル基、6-フェニルヘキシルオキシカルボニル基、2-ベンジルオ

キシベンジルオキシカルボニル基、3-ベンジルオキシベンジルオキシカルボニ ル基、4-ベンジルオキシベンジルオキシカルボニル基、2,4-ジベンジルオ キシベンジルオキシカルボニル基、3、4、5-ベンジルオキシベンジルオキシ カルボニル基、2ートリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、2ーメチ ルベンジルオキシカルボニル基、3-メチルベンジルオキシカルボニル基、4-メチルベンジルオキシカルボニル基、2,6-ジメチルベンジルオキシカルボニ ル基、2,4,6-トリメチルベンジルオキシカルボニル基、2,3-ジトリフ ルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、2,4,6-トリ(トリフルオロメ チル) ベンジルオキシカルボニル基、2-メトキシベンジルオキシカルボニル基、 3-メトキシベンジルオキシカルボニル基、4-メトキシベンジルオキシカルボ 10 ニル基、2,4-ジメトキシベンジルオキシカルボニル基、3,4,5ートリメ トキシベンジルオキシカルボニル基、2,5-ジトリフルオロメトキシベンジル オキシカルボニル基、2,4,6-トリ(トリフルオロメトキシ)ベンジルオキ シカルボニル基、3-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、4-ト リフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、2-トリフルオロメトキシベン 15 ジルオキシカルボニル基、3-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル 基、4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、2-(2-トリフ) ルオロメチルフェニル)エトキシカルボニル基、2-(3-トリフルオロメチル フェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エ トキシカルボニル基、2-(2-トリフルオロメトキシフェニル)エトキシカル 20 ボニル基、2-(3-トリフルオロメトキシフェニル)エトキシカルボニル基、 2- (4-トリフルオロメトキシフェニル) エトキシカルボニル基、3-(4-ベンジルオキシフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(3-ベンジルオキシ フェニル)プロポキシカルボニル基、3-(2-ベンジルオキシフェニル)プロ ポキシカルボニル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシカル 25ボニル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシカルボニル基、 3- (4-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(2-トリフルオロメトキシフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(3-トリフル オロメトキシフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(4-トリフルオロメト

キシフェニル)プロポキシカルボニル基、4-(3-ベンジルオキシフェニル) ブトキシカルボニル基、4-(4-ベンジルオキシフェニル) ブトキシカルボニ ル基、4-(3-トリフルオロメチルフェニル)ブトキシカルボニル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル) ブトキシカルボニル基、5-(3-ベンジ ルオキシフェニル)ペントキシカルボニル基、5-(4-ベンジルオキシフェニ ル) ペントキシカルボニル基、5-(4-トリフルオロメチルフェニル) ペント キシカルボニル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペントキシカルボ ニル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ペントキシカルボニル基、 6-(3-ベンジルオキシフェニル) ヘキシルオキシカルボニル基、6-(4-10 ベンジルオキシフェニル) ヘキシルオキシカルボニル基、6-[3-(2-フェ ネチルオキシ)フェニル] ヘキシルオキシカルボニル基、6-[4-(2-フェ ネチルオキシ)フェニル] ヘキシルオキシカルボニル基、6-[3-(3-フェ ニルプロポオキシ)フェニル] ヘキシルオキシカルボニル基、6-[4-(4-フェニルブトキシ)フェニル] ヘキシルオキシカルボニル基、6-[4-(5-フェニルペンチルオキシ)フェニル] ヘキシルオキシカルボニル基、6-「4-15 (6-フェニルヘキシルオキシ)フェニル]ヘキシルオキシカルボニル基、6-(3-トリフルオロメチルフェニル) ヘキシルオキシカルボニル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル) ヘキシルオキシカルボニル基、6-(4-トリフ ルオロメトキシフェニル)ヘキシルオキシカルボニル基、2-トリフルオロメチ ルー4-ベンジルオキシベンジルオキシカルボニル基、3-トリフルオロメトキ 20シー5-ベンジルオキシベンジルオキシカルボニル基、2-トリフルオロメチル - 3 - トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基等を挙げることができ る。

フェニルC1~6アルキル基 [フェニル環上には、フェニルC1~6アルコキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]としては、例えば、ベンジル基、1ーフェネチル基、2ーフェネチル基、3ーフェニルプロピル基、2ーフェニルプロピル基、4ーフェニルブチル基、5ーフェニルペンチル基、6ーフェニ

ルヘキシル基、2-ベンジルオキシベンジル基、3-ベンジルオキシベンジル基、 4-ベンジルオキシベンジル基、2,4-ジベンジルオキシベンジル基、2,4, 6-トリベンジルオキシベンジル基、2-(2-フェネチルオキシ)ベンジル基、 3-(2-フェネチルオキシ)ベンジル基、4-(2-フェネチルオキシ)ベン ジル基、2-(3-フェニルプロポキシ)ベンジル基、3-(3-フェニルプロ ポキシ)ベンジル基、4-(3-フェニルプロポキシ)ベンジル基、2-(4-フェニルブトキシ)ベンジル基、3-(4-フェニルブトキシ)ベンジル基、4 - (4-フェニルブトキシ) ベンジル基、2-(5-フェニルペンチルオキシ) ベンジル基、3-(5-フェニルペンチルオキシ)ベンジル基、4-(5-フェ 10 ニルペンチルオキシ)ベンジル基、2-(6-フェニルヘキシルオキシ)ベンジ ル基、3-(6-フェニルヘキシルオキシ)ベンジル基、4-(6-フェニルヘ キシルオキシ)ベンジル基、2-メチルベンジル基、2,3-ジメチルベンジル 基、3、4-ジメチルベンジル基、3,5-ジメチルベンジル基、2,6-ジメ チルベンジル基、2、4-ジメチルベンジル基、2、5-ジメチルベンジル基、 2, 4, 6-トリメチルベンジル基、3, 5-ジトリフルオロメチルベンジル基、 15 2, 4, 6-トリフルオロメチルベンジル基、2-トリフルオロメチルベンジル 基、3-トリフルオロメチルベンジル基、4-トリフルオロメチルベンジル基、 2-トリフルオロメトキシベンジル基、3-トリフルオロメトキシベンジル基、 4-トリフルオロメトキシベンジル基、3-メトキシベンジル基、2,3-ジメ トキシベンジル基、3,4-ジメトキシベンジル基、3,5-ジメトキシベンジ 20 ル基、2,6-ジメトキシベンジル基、2,4-ジメトキシベンジル基、2,5 - ジメトキシベンジル基、2,4,6-トリメトキシベンジル基、2,6-ジト リフルオロメトキシベンジル基、2、3、4-トリフルオロメトキシベンジル基、 1- (4-ベンジルオキシフェニル) エチル基、1- (3-ベンジルオキシフェ ニル) エチル基、1-(2-ベンジルオキシフェニル) エチル基、1-(2-ト リフルオロメチルフェニル) エチル基、1-(3-トリフルオロメチルフェニ ル) エチル基、1-(4-トリフルオロメチルフェニル) エチル基、1-(2-トリフルオロメトキシフェニル) エチル基、1-(3-トリフルオロメトキシフ エニル) エチル基、1-(4-トリフルオロメトキシフェニル) エチル基、2-

(4-ベンジルオキシフェニル) エチル基、2-(3-ベンジルオキシフェニ ル) エチル基、2-(2-ベンジルオキシフェニル) エチル基、2-(2-トリ フルオロメチルフェニル) エチル基、2-(3-トリフルオロメチルフェニル) エチル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル) エチル基、2-(2-トリ フルオロメトキシフェニル) エチル基、2-(3-トリフルオロメトキシフェニ ル) エチル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニル) エチル基、3-(4 ーベンジルオキシフェニル)プロピル基、3-(3-ベンジルオキシフェニル) プロピル基、3-(2-ベンジルオキシフェニル)プロピル基、3-(2-トリ フルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニ ル)プロピル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル) プロピル基、3-(3-トリフルオロメト キシフェニル)プロピル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)プロピ ル基、4-(3-トリフルオロメチルフェニル)ブチル基、5-(4-トリフル オロメチルフェニル)ペンチル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペ ンチル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ペンチル基、6-(3-15 トリフルオロメチルフェニル) ヘキシル基、6-(4-トリフルオロメチルフェ ニル) ヘキシル基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ヘキシル基、2 ートリフルオロメチルー3ートリフルオロメトキシベンジル基、2-ベンジルオ キシー3ートリフルオロメトキシベンジル基、3ーフェノキシー4ートリフルオ 20 ロメチルベンジル基等のフェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、フェ ニルC1~6アルコキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基 及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれ た基を1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

ビフェニリルC1~6アルコキシカルボニル基としては、例えば、2ービフェ 25 ニリルメトキシカルボニル基、2-(2ービフェニリル)エトキシカルボニル基、3-(2ービフェニリル)プロポキシカルボニル基、4-(2ービフェニリル)ブトキシカルボニル基、5-(2ービフェニリル)ペントキシカルボニル基、6-(2ービフェニリル)ヘキシルオキシカルボニル基、3ービフェニリルメトキシカルボニル基、2-(3ービフェニリル)エトキシカルボニル基、3-(3-

ビフェニリル)プロポキシカルボニル基、4-(3-ビフェニリル)ブトキシカルボニル基、5-(3-ビフェニリル)ペントキシカルボニル基、6-(3-ビフェニリル)へキシルオキシカルボニル基、4-ビフェニリルメトキシカルボニル基、2-(4-ビフェニリル)エトキシカルボニル基、3-(4-ビフェニリル)プロポキシカルボニル基、4-(4-ビフェニリル)ブトキシカルボニル基、5-(4-ビフェニリル)ペントキシカルボニル基、6-(4-ビフェニリル)ペントキシカルボニル基、6-(4-ビフェニリル)ペキシルオキシカルボニル基等を挙げることができる。

ベンゾオキサゾリルC1~6アルキル基(ベンゾオキサゾール環上には、少な くとも1個のオキソ基が置換していてもよい)としては、例えば、ベンゾオキサ ゾールー 2 ーイルメチル基、ベンゾオキサゾールー 4 ーイルメチル基、ベンゾオ 10 キサゾールー5ーイルメチル基、ベンゾオキサゾールー6ーイルメチル基、ベン ゾオキサゾールー7-イルメチル基、2-(ベンゾオキサゾールー4-イル) エ チル基、1-(ベンゾオキサゾール-5-イル)エチル基、3-(ベンゾオキサ ゾールー6ーイル)プロピル基、4-(ベンゾオキサゾールー7-イル)ブチル 基、5-(ベンゾオキサゾール-2-イル)ペンチル基、6-(ベンゾオキサゾ 15 ールー4-イル) ヘキシル基、2-メチルー3-(ベンゾオキサゾールー5-イ ル) プロピル基、1, 1-ジメチル-2-(ベンゾオキサゾール-2-イル) エ チル基、(2,3-ジヒドロ-2-オキソーベンゾオキサゾール-3-イル)メ (2, 3-ジヒドロ-2-オキソーベンゾオキサゾール-4-イル)メ チル基、 (2, 3-ジヒドロ-2-オキソーベンゾオキサゾール-5-イル) メ 20 チル基、 (2, 3-ジヒドロ-2-オキソーベンゾオキサゾールー6-イル) メ チル基、 チル基、(2,3-ジヒドロ-2-オキソーベンゾオキサゾール-7-イル)メ チル基、2-(ベンゾオキサゾール-6-イル)エチル基、2-(ベンゾオキサ ゾールー7ーイル) エチル基、2-(2,3-ジヒドロー2-オキソーベンゾオ キサゾール-3-イル)エチル基、2-(2,3-ジヒドロ-2-オキソーベン 25 ゾオキサゾールー4ーイル)エチル基、2-(2,3-ジヒドロー2-オキソー ベンゾオキサゾールー5ーイル) エチル基、2-(2,3-ジヒドロー2ーオキ ソーベンゾオキサゾールー6ーイル)エチル基、2-(2,3-ジヒドロー2-オキソーベンゾオキサゾールー7ーイル)エチル基、3-(ベンゾオキサゾール

-2-イル)プロピル基、3-(ベンゾオキサゾール-4-イル)プロピル基、 3- (ベンゾオキサゾール-5-イル) プロピル基、3- (ベンゾオキサゾール - 7 - イル)プロピル基、3 - (2、3 - ジヒドロ-2 - オキソーベンゾオキサ ゾールー3-イル)プロピル基、3-(2,3-ジヒドロ-2-オキソーベンゾ オキサゾールー4ーイル)プロピル基、3-(2,3-ジヒドロ-2-オキソー ベンゾオキサゾールー5ーイル)プロピル基、3-(2,3-ジヒドロ-2-オ キソーベンゾオキサゾールー6ーイル)プロピル基、3-(2,3-ジヒドロー 2-オキソーベンゾオキサゾール-7-イル)プロピル基、4-(ベンゾオキサ ゾールー2-イル)ブチル基、4-(ベンゾオキサゾール-4-イル)ブチル基、 4-(ベンゾオキサゾール-5-イル)ブチル基、4-(ベンゾオキサゾール-10 6ーイル) ブチル基、4ー(2,3-ジヒドロー2ーオキソーベンゾオキサゾー ルー3-イル)ブチル基、4-(2,3-ジヒドロ-2-オキソーベンゾオキサ ゾールー4ーイル)ブチル基、4-(2,3-ジヒドロ-2-オキソーベンゾオ キサゾールー5ーイル)ブチル基、4-(2,3-ジヒドロー2-オキソーベン ゾオキサゾールー6ーイル)ブチル基、4-(2,3-ジヒドロー2-オキソー 15 ベンゾオキサゾールー7ーイル)ブチル基、5ー(ベンゾオキサゾールー4ーイ ル)ペンチル基、5-(ベンゾオキサゾール-5-イル)ペンチル基、5-(ベ ンゾオキサゾールー6ーイル)ペンチル基、5-(ベンゾオキサゾール-7-イ ル)ペンチル基、5-(2,3-ジヒドロ-2-オキソーベンゾオキサゾール-3-イル)ペンチル基、5-(2,3-ジヒドロ-2-オキソーベンゾオキサゾ 20 ールー4ーイル)ペンチル基、5ー(2,3-ジヒドロー2-オキソーベンゾオ キサゾールー5ーイル)ペンチル基、5-(2,3-ジヒドロ-2-オキソーベ ンゾオキサゾールー6ーイル)ペンチル基、5-(2,3-ジヒドロ-2-オキ ソーベンゾオキサゾールー7ーイル)ペンチル基、6-(ベンゾオキサゾールー 25 2-イル) ヘキシル基、6-(ベンゾオキサゾール-5-イル) ヘキシル基、6 - (ベンゾオキサゾール-6-イル) ヘキシル基、6-(ベンゾオキサゾール-7-イル) ヘキシル基、6-(2,3-ジヒドロ-2-オキソーベンゾオキサゾ ールー3ーイル)へキシル基、6-(2,3-ジヒドロー2-オキソーベンゾオ キサゾールー4ーイル) ヘキシル基、6ー(2,3ージヒドロー2ーオキソーベ

ンゾオキサゾールー5ーイル)へキシル基、6ー(2、3ージヒドロー2ーオキ ソーベンゾオキサゾールー6ーイル)へキシル基、6ー(2、3ージヒドロー2 ーオキソーベンゾオキサゾールー7ーイル)へキシル基等を挙げることができる。 ベンゾオキサゾリル基としては、例えばベンゾオキサゾールー2ーイル基、ベ ンゾオキサゾールー4ーイル基、ベンゾオキサゾールー5ーイル基、ベンゾオキ サゾールー6ーイル基、ベンゾオキサゾールー7ーイル基等を挙げることができる。

オキサゾリルC1~6アルキル基(オキサゾール環上には、フェニル基及びC 1~6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していても よい)としては、例えば、オキサゾール-2-イルメチル基、オキサゾール-4 10 ーイルメチル基、オキサゾールー5ーイルメチル基、2ー(オキサゾールー2ー イル) エチル基、1-(オキサゾール-4-イル) エチル基、3-(オキサゾー ルー5-イル)プロピル基、4-(オキサゾール-2-イル)ブチル基、5-(オキサゾールー4ーイル) ペンチル基、6-(オキサゾールー5ーイル) ヘキ - シル基、2-メチルー3-(オキサゾールー2-イル)プロピル基、1,1-ジ 15 メチル-2-(オキサゾール-5-イル)エチル基、(4-メチルオキサゾール - 2 - イル) メチル基、(5 - メチルオキサゾール - 2 - イル)メチル基、(4 -エチルオキサゾールー2-イル)メチル基、(5-エチルオキサゾールー2-イル)メチル基、(4-n-プロピルオキサゾール-2-イル)メチル基、(5 - n – プロピルオキサゾールー 2 – イル)メチル基、(4 – n – ブチルオキサゾ 20 ールー2-イル)メチル基、(5-n-ブチルオキサゾールー2-イル)メチル 基、(4-n-ペンチルオキサゾール-2-イル)メチル基、(5-n-ペンチ ルオキサゾールー2ーイル)メチル基、(4-n-ヘキシルオキサゾールー2-イル) メチル基、(5-n-ヘキシルオキサゾール-2-イル) メチル基、2-(オキサゾールー4ーイル)エチル基、2-(オキサゾールー5-イル)エチル 25 基、2-(4-メチルオキサゾール-2-イル)エチル基、2-(5-メチルオ キサゾール-2-イル)エチル基、2-(4-エチルオキサゾール-2-イル) エチル基、2-(5-エチルオキサゾール-2-イル)エチル基、2-(4-n ープロピルオキサゾールー2ーイル)エチル基、2-(5-n-プロピルオキサ

ゾールー2-イル)エチル基、2-(4-n-ブチルオキサゾール-2-イル) エチル基、2-(5-n-ブチルオキサゾール-2-イル)エチル基、2-(4 - n - ペンチルオキサゾール-2-イル) エチル基、2-(5-n-ペンチルオ キサゾールー2-イル)エチル基、2-(4-n-ヘキシルオキサゾール-2-イル) エチル基、2-(5-n-ヘキシルオキサゾール-2-イル) エチル基、 3- (オキサゾール-2-イル) プロピル基、3- (オキサゾール-4-イル) プロピル基、3-(4-メチルオキサゾール-2-イル)プロピル基、3-(5 ーメチルオキサゾールー2ーイル)プロピル基、3-(4-エチルオキサゾール - 2 - イル)プロピル基、3 - (5 - エチルオキサゾール - 2 - イル)プロピル 基、3-(4-n-プロピルオキサゾール-2-イル)プロピル基、3-(5-10 n-プロピルオキサゾール-2-イル)プロピル基、3-(4-n-ブチルオキ サゾールー2ーイル)プロピル基、3-(5-n-ブチルオキサゾール-2-イ ル)プロピル基、3-(4-n-ペンチルオキサゾール-2-イル)プロピル基、 3-(5-n-ペンチルオキサゾールー2-イル) プロピル基、<math>3-(4-n-1)ヘキシルオキサゾール-2-イル)プロピル基、3-(5-n-ヘキシルオキサ ゾールー 2 ーイル)プロピル基、4 ー (オキサゾールー4ーイル)ブチル基、4 - (オキサゾール-5-イル) ブチル基、4-(4-メチルオキサゾール-2-イル)ブチル基、4-(5-メチルオキサゾール-2-イル)ブチル基、4-(4-エチルオキサゾール-2-イル) ブチル基、4-(5-エチルオキサゾー ルー2ーイル)ブチル基、4ー(4-n-プロピルオキサゾールー2ーイル)ブ 20チル基、4-(5-n-プロピルオキサゾール-2-イル)ブチル基、4-(4 - n - ブチルオキサゾール- 2 - イル)ブチル基、4 - (5 - n - ブチルオキサ ゾールー2-イル)ブチル基、4-(4-n-ペンチルオキサゾール-2-イ ル)ブチル基、4-(5-n-ペンチルオキサゾール-2-イル)ブチル基、4 - (4-n-ヘキシルオキサゾール-2-イル)ブチル基、4-(5-n-ヘキ 25 シルオキサゾール-2-イル)ブチル基、5-(オキサゾール-2-イル)ペン チル基、5-(オキサゾール-5-イル)ペンチル基、6-(オキサゾール-2 ーイル) ヘキシル基、6-(オキサゾール-4-イル) ヘキシル基、(5-フェ ニルオキサゾール-2-イル)メチル基、(2-フェニルオキサゾール-4-イ

ル)メチル基、(2-フェニルオキサゾール-5-イル)メチル基、2-(5-フェニルオキサゾール-2-イル)エチル基、2-(2-フェニルオキサゾール-4-イル)エチル基、2-(2-フェニルオキサゾール-5-イル)エチル基、3-(5-フェニルオキサゾール-2-イル)プロピル基、3-(2-フェニルオキサゾール-4-イル)プロピル基、3-(2-フェニルオキサゾール-5-イル)プロピル基、4-(5-フェニルオキサゾール-2-イル)ブチル基、4-(2-フェニルオキサゾール-4-イル)ブチル基、4-(2-フェニルオキサゾール-5-イル)ブチル基、5-(5-フェニルオキサゾール-2-イル)ペンチル基、5-(2-フェニルオキサゾール-4-イル)ペンチル基、5-(2-フェニルオキサゾール-4-イル)ペンチル基、5-(2-フェニルオキサゾール-4-イル)ペンチル基、5-

10 (2-フェニルオキサゾール-5-イル) ペンチル基、(2-フェニル-4-メ チルオキサゾール-5-イル) メチル基、(2, 4-ジメチルオキサゾール-5 ーイル) メチル基、(2, 5-ジフェニルオキサゾール-4-イル) メチル基等 のオキサゾリルC1~6アルキル基(オキサゾール環上には、フェニル基及びC 1~6アルキル基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい)を 挙げることができる。

テトラゾリル基 [テトラゾール環上には、C1~6アルキル基又はハロゲン原 子を有することのあるフェニル基が置換していてもよい]としては、例えば、5 - (1H) -テトラゾリル基、1-メチル-5- (1H) -テトラゾリル基、1 ーエチルー5- (1H) ーテトラゾリル基、1-n-プロピルー5- (1H) -20 テトラゾリル基、1-イソプロピルー5-(1H)-テトラゾリル基、1-n-ブチルー5- (1H) -テトラゾリル基、1- (2-メチルプロピル) -5-(1H) ーテトラゾリル基、1-n-ペンチル-5-(1H) ーテトラゾリル基、 **1-n-ヘキシル-5-(1H)-テトラゾリル基、1-フェニル-5-(1** H) ーテトラゾリル基、1ー(4ークロロフェニル)-5-(1H)-テトラゾ リル基、1-(4-フルオロフェニル)-5-(1H)-テトラゾリル基、1-25 (4-ブロモフェニル) -5-(1H) -テトラゾリル基、<math>1-(3, 4-ジフ)ルオロフェニル) - 5 - (1H) -テトラゾリル基、1 - (3, 4 - ジクロロフ ェニル) -5-(1H) ーテトラブリル基、1-(3,4,5-トリクロロフェ ニル)-5-(1H)-テトラゾリル基等のテトラゾリル基(テトラゾール環上

には、置換基としてC1~6アルキル基又はハロゲン原子を1~3個有すること のあるフェニル基で置換していてもよい)を挙げることができる。

C1~8アルキル基とは、炭素原子が1ないし8から構成される直鎖状又は分 岐鎖状のアルキル基であって、例えば、メチル基、エチル基、nープロピル基、 5 イソプロピル基、nーブチル基、イソブチル基、tertーブチル基、secー ブチル基、nーペンチル基、ネオペンチル基、nーヘキシル基、イソヘギシル基、 3ーメチルペンチル基、nーヘプチル基、6ーメチルヘプチル基、nーオクチル 基、3、5ージメチルヘキシル基等を挙げることができる。

20 C1~6アルコキシカルボニルーC1~6アルキル基とは、既に定義されたC1~6アルコキシカルボニル基が置換した上記で定義したC1~6アルキル基であって、例えば、メトキシカルボニルメチル基、エトキシカルボニルメチル基、プロポキシカルボニルメチル基、イソプロポキシカルボニルメチル基、nーブトキシカルボニルメチル基、tertーブトキシカルボニルメチル基、ペントキシカルボニルメチル基、nーヘキシルオキシカルボニルメチル基、2ー(メトキシカルボニル) エチル基、2ー(エトキシカルボニル) エチル基、2ー(1ープロポキシカルボニル) エチル基、2ー(イソプロポキシカルボニル) エチル基、2ー(nーブトキシカルボニル) エチル基、2ー(tertーブトキシカルボニル) エチル基、2ー(1ープロスチンカルボニル) エチル基、2ー(1ープロスチンカルボニル) エチル基、2ー(1ープロスチンカルボニル) エチル基、2ー(1ーブトキシカルボニル) エチル基、2ー(1ーペキシカルボニル) エチル基、2ー(1ーペキシカルボニル) エチル基、2ー(1ーペキシカルボニル) エチル基、2ー(1ーペキシ

ルオキシカルボニル)エチル基、3-(メトキシカルボニル)プロピル基、3-(エトキシカルボニル)プロピル基、3-(1-プロポキシカルボニル)プロピ ル基、3-(イソプロポキシカルボニル)プロピル基、3-(n-ブトキシカル ボニル)プロピル基、3-(tert-ブトキシカルボニル)プロピル基、3-(3-ペントキシカルボニル) プロピル基、3- (n-ヘキシルオキシカルボニ 5 ル)プロピル基、4-(メトキシカルボニル)ブチル基、4-(エトキシカルボ ニル)ブチル基、4-(1-プロポキシカルボニル)ブチル基、4-(イソプロ ポキシカルボニル)ブチル基、4-(n-ブトキシカルボニル)ブチル基、4-(tertーブトキシカルボニル) ブチル基、5-(メトキシカルボニル) ペン チル基、5-(エトキシカルボニル)ペンチル基、5-(プロポキシカルボニ 10 ル) ペンチル基、5-(イソプロポキシカルボニル) ペンチル基、5-(n-ブ トキシカルボニル)ペンチル基、5-(tert-ブトキシカルボニル)ペンチ ル基、6-(メトキシカルボニル)へキシル基、6-(エトキシカルボニル)へ キシル基、6-(プロポキシカルボニル)へキシル基、6-(イソプロポキシカ ルボニル) ヘキシル基、6- (n-ブトキシカルボニル) ヘキシル基、6-15

C3~8シクロアルキル基とは、構成する炭素原子数が3個ないしは8個の3 員環、4員環、5員環、6員環、7員環及び8員環の環状アルキル基であって、 例えば、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシ ル基、シクロヘプチル基、シクロオクチル基、3,4ージメチルシクロペンチル 基、3,3ージメチルシクロヘキシル基等を挙げることができる。

(tertーブトキシカルボニル) ヘキシル基等を挙げることができる。

フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)とは、無置換のフェニルC1~6アルキル基並びにそれらの基を構成するフェニル環上にハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選択された基が1~5個、好ましくは1~3個置換されている基であって、例えば、ベンジル基、1-フェネチル基、2-フェネチル基、3-フェニルプロピル基、

2-フェニルプロピル基、4-フェニルブチル基、5-フェニルペンチル基、4 ーフェニルペンチル基、6ーフェニルヘキシル基、2ーフルオロベンジル基、3 - フルオロベンジル基、4-フルオロベンジル基、2-クロロベンジル基、3-クロロベンジル基、4ークロロベンジル基、2ーブロモベンジル基、3ーブロモ 5 ベンジル基、4ーブロモベンジル基、2ーヨードベンジル基、3ーヨードベンジ ル基、4-ヨードベンジル基、2、3-ジフルオロベンジル基、3、4-ジフル オロベンジル基、3,5-ジフルオロベンジル基、2,4-ジフルオロベンジル 基、2,6-ジフルオロベンジル基、2,3-ジクロロベンジル基、3,4-ジ クロロベンジル基、3,5ージクロロベンジル基、2,4ージクロロベンジル基、 2,6-ジクロロベンジル基、2-フルオロー4-ブロモベンジル基、4-クロ 10 ロー3-フルオロベンジル基、2,3,4-トリクロロベンジル基、3,4,5 ートリフルオロベンジル基、2、4、6ートリクロロベンジル基、4ーイソプロ ピルベンジル基、4-n-ブチルベンジル基、4-メチルベンジル基、2-メチ ルベンジル基、3-メチルベンジル基、2,4-ジメチルベンジル基、2,3-- ジメチルベンジル基、2,6-ジメチルベンジル基、3,5-ジメチルベンジル 15 基、2,5-ジメチルベンジル基、2,4,6-トリメチルベンジル基、3,5 ージトリフルオロメチルベンジル基、2,3,4,5,6-ペンタフルオロベン ジル基、4-イソプロポキシベンジル基、4-n-ブトキシベンジル基、4-メ トキシベンジル基、2-メトキシベンジル基、3-メトキシベンジル基、2,4 - ージメトキシベンジル基、2,3-ジメトキシベンジル基、2,6-ジメトキシ 20 ベンジル基、3,5-ジメトキシベンジル基、2,5-ジメトキシベンジル基、 2, 4, 6-トリメトキシベンジル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシベンジ ル基、2-イソプロポキシベンジル基、3-クロロ-4-メトキシベンジル基、 2-クロロ-4-トリフルオロメトキシベンジル基、3-メチルー4-フルオロ ベンジル基、4-ブロモー3ートリフルオロメチルベンジル基、2-トリフルオ ロメチルベンジル基、3ートリフルオロメチルベンジル基、4ートリフルオロメ チルベンジル基、2ーペンタフルオロエチルベンジル基、3ーペンタフルオロエ チルベンジル基、4ーペンタフルオロエチルベンジル基、2ートリフルオロメト キシベンジル基、3-トリフルオロメトキシベンジル基、4-トリフルオロメト

キシベンジル基、2ーペンタフルオロエトキシベンジル基、3ーペンタフルオロ エトキシベンジル基、4ーペンタフルオロエトキシベンジル基、2-(2-トリ フルオロメチルフェニル) エチル基、2-(3-トリフルオロメチルフェニル) エチル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(2-トリ フルオロメトキシフェニル)エチル基、3-トリフルオロメトキシフェニル)エ チル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、2-(2-ペン タフルオロエトキシフェニル) エチル基、2-(3-ペンタフルオロエトキシフ ェニル) エチル基、2- (4-ペンタフルオロエトキシフェニル) エチル基、3 - (2-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(3-トリフルオロメ チルフェニル)プロピル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロピル 10 基、3-(2-トリフルオロメトキシフェニル)プロピル基、3-(3-トリフ ルオロメトキシフェニル)プロピル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニ ル) プロピル基、3-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル) プロピル基、3 - (4-ペンタフルオロエトキシフェニル)プロピル基、4-(3-ペンタフル オロエトキシフェニル)ブチル基、5-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペ 15 ンチル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチル基、4-(4-ト リフルオロメトキシフェニル)ペンチル基、6-(3-トリフルオロメチルフェ ニル) ヘキシル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル) ヘキシル基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ヘキシル基等を挙げることができる。

フェニル基(フェニル環には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基、C1~6アルカノイル基、カルボキシル基、C1~6アルコキシカルボニル基、フェニルC1~6アルコキシカルボニル基、カルバモイル基、C1~6アルキルカルバモイル基、アミノスルホニル基及びモルホリノ基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい)としては、例えば、フェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-ブロモフェニル基、3-ブロモフェニル基、4-クロロフェニル基、2-ブロモフェニル基、3-ブロモフェニル基、4-ブロモフェニル基、3-ブロモフェニル基、3-ブロモフェニル基、4-ブロモフェニル基、3-ブロモフェニル基、4-ブロモフェニル基、3-ブロモフェニル基、3-ブロモフェニル基、4-ブロエフェニル基、2-ブロエフェニル基、3-ブロエフェニル基、4-ブロエフェニル基、2-ブロエフェニル基、3-ブロエフェニル基、4-ブロエフェニル基、2-ブロエフェニル基、3-ブロエフェニル基、4-ブロエフェニル基、2-ブロエコル基、3-ブロエール基、4-ブロエフェニル基、2-ブロエコル基、3-ブロエール基、4-ゴロエフェニル基、2-ブロエニル基、3-ブロエール基、4-ゴロエフェニル基、2-ブロエール基、3-ブロエール基、4-ゴロエール基、2-ブロスニードフェニル基、4-ゴロエール基、2-ブロスニートアフェニル基、4-ゴロエール基、2-ブロスニートアフェニル基、4-ゴロエール基、2-ブロスニートアフェニル基

3, 4ージフルオロフェニル基、3, 5ージフルオロフェニル基、2, 4ージフ ルオロフェニル基、2,6-ジフルオロフェニル基、2,3-ジクロロフェニル 基、3、4ージクロロフェニル基、3、5ージクロロフェニル基、2、4ージク ロロフェニル基、2,6-ジクロロフェニル基、3,4,5-トリフルオロフェ ニル基、3、4、5ートリクロロフェニル基、2、4、6ートリフルオロフェニ ル基、2、4、6ートリクロロフェニル基、2ーフルオロー4ーブロモフェニル 基、4-クロロ-3-フルオロフェニル基、2,3,4-トリクロロフェニル基、 4-イソプロピルフェニル基、4-n-ブチルフェニル基、2,4-ジメチルフ ェニル基、2,3-ジメチルフェニル基、2,6-ジメチルフェニル基、3,5 ジメチルフェニル基、2,5ージメチルフェニル基、2,4,6ートリメチル 10 フェニル基、3,5-ジトリフルオロメチルフェニル基、4-n-ブトキシフェ ニル基、2,4-ジメトキシフェニル基、2,3-ジメトキシフェニル基、2, 6-ジメトキシフェニル基、3、5-ジメトキシフェニル基、2、5-ジメトキ シフェニル基、3,5ージトリフルオロメトキシフェニル基、3ークロロー4ー メトキシフェニル基、2ークロロー4ートリフルオロメトキシフェニル基、3ー 15 メチルー4ーフルオロフェニル基、4ーブロモー3ートリフルオロメチルフェニ ル基、2ーメチルフェニル基、3ーメチルフェニル基、4ーメチルフェニル基、 2ートリフルオロメチルフェニル基、3ートリフルオロメチルフェニル基、4ー トリフルオロメチルフェニル基、2ーペンタフルオロエチルフェニル基、3ーペ 20 - ンタフルオロエチルフェニル基、4-ペンタフルオロエチルフェニル基、2-イ ソプロピルフェニル基、3ーイソプロピルフェニル基、2-tert-ブチルフ エニル基、3-tertーブチルフェニル基、4-tertーブチルフェニル基、 2-sec-ブチルフェニル基、3-sec-ブチルフェニル基、4-sec-ブチルフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、3-n-ヘプ タフルオロプロピルフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、 254-n-ペンチルフェニル基、4-n-ヘキシルフェニル基、2-メトキシフェ ニル基、3-メトキシフェニル基、4-メトキシフェニル基、2,3-ジメトキ シフェニル基、3-フルオロー2-メトキシフェニル基、2-フルオロー3-メ トキシフェニル基、2ークロロー4ーメトキシフェニル基、2、3、4ートリメ

トキシフェニル基、3,4,5-トリメトキシフェニル基、2,4,6-トリメ トキシフェニル基、2ートリフルオロメトキシフェニル基、3ートリフルオロメ トキシフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基、2-ペンタフルオロ エトキシフェニル基、3ーペンタフルオロエトキシフェニル基、4ーペンタフル オロエトキシフェニル基、2-イソプロポキシフェニル基、3-イソプロポキシ フェニル基、4-イソプロポキシフェニル基、2-tert-ブトキシフェニル 基、3-tertーブトキシフェニル基、4-tertーブトキシフェニル基、 2-secーブトキシフェニル基、3-secーブトキシフェニル基、4s e c ーブトキシフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、 3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロポ 10 キシフェニル基、4ーペントキシフェニル基、4-ヘキシルオキシフェニル基、 2-ホルミルフェニル基、3-ホルミルフェニル基、4-ホルミルフェニル基、 2-アセチルフェニル基、3-アセチルフェニル基、4-アセチルフェニル基、 2-プロピオニルフェニル基、3-プロピオニルフェニル基、4-プロピオニル フェニル基、2ーブチリルフェニル基、3ーブチリルフェニル基、4ーブチリル 15 フェニル基、2-ペンタノイルフェニル基、3-ペンタノイルフェニル基、4-ペンタノイルフェニル基、2-ヘキサノイルフェニル基、3-ヘキサノイルフェ ニル基、4-ヘキサノイルフェニル基、2-メトキシカルボニルフェニル基、3 ーメトキシカルボニルフェニル基、4-メトキシカルボニルフェニル基、2-エ トキシカルボニルフェニル基、3-エトキシカルボニルフェニル基、4-エトキ 20 シカルボニルフェニル基、2ープロポキシカルボニルフェニル基、3ープロポキ シカルボニルフェニル基、4ープロポキシカルボニルフェニル基、2ーブトキシ カルボニルフェニル基、3-ブトキシカルボニルフェニル基、4-ブトキシカル ボニルフェニル基、2-tert-ブトキシカルボニルフェニル基、3tert-ブトキシカルボニルフェニル基、4-tert-ブトキシカルボニル 25

25 tertーブトキシカルボニルフェニル基、4-tertーブトキシカルボニルフェニル基、2-ペントキシカルボニルフェニル基、3-ペントキシカルボニルフェニル基、4-ペントキシカルボニルフェニル基、2-ヘキシルオキシカルボニルフェニル基、3-ヘキシルオキシカルボニルフェニル基、4-ヘキシルオキシカルボニルフェニル基、3-ベン

ジルオキシカルボニルフェニル基、4ーベンジルオキシカルボニルフェニル基、2ーカルボキシルフェニル基、3ーカルボキシルフェニル基、4ーカルボキシルフェニル基、2ーアミノスルホニルフェニル基、3ーアミノスルホニルフェニル基、4ーアミノスルホニルフェニル基、2ーカルバモイルフェニル基、3ーカルバモイルフェニル基、4ーカルバモイルフェニル基、2ーメチルカルバモイルフェニル基、3ーメチルカルバモイルフェニル基、4ーメチルカルバモイルフェニル基、4ーエチルカルバモイルフェニル基、2ージメチルカルバモイルフェニル基、3ージメチルカルバモイルフェニル基、3ージメチルカルバモイルフェニル基、2ージエチルカルバモイルフェニル基、4ージエチルカルバモイルフェニル基、4ージエチルカルバモイルフェニル基、4ージエチルカルバモイルフェニル基、4ージエチルカルバモイルフェニル基、4ージエチルカルバモイルフェニル基、4ーエルホリノフェニル基、3ーモルホリノフェニル基、3ーモルホリノフェニル基、4ーモルホリノフェニル基、3ーモルホリノフェニル基、3ーモルホリノフェニル基、4ーモルホリノフェニル基、4ーモルホリノフェニル基、3ーモルホリノフェニル基、4ーモルホリノフェニル基、3ーモルホリノフェニル基、4ーモルホリノフェニル基、5ーモルホリノフェニル基、5ーモルホリノフェニル基、4ーモルホリノフェニル基、4ーモルホリノフェニル基、5ーエルホリノフェニル基、4ーモルホリノフェニル基を挙げることができる。

C1~6アルキルカルバモイル基とは、カルバモイル(-CONH₂)基を構成する1個又は2個の水素が上で定義されたC1~6アルキル基で置換された基であって、例えば、Nーメチルカルバモイル基、N, Nージメチルカルバモイル基、nーエチルカルバモイル基、N-nープロピルカルバモイル基、Nーイソプロピルカルバモイル基、Nーnープチルカルバモイル基、Nーtertーブチルカルバモイル基、Nーnーペンチルカルバモイル基、Nーnーへキシルカルバモイル基、NーメチルーNーnープロピルカルバモイル基、NーメチルーNーnープロピルカルバモイル基、NーメチルーNーnープロピルカルバモイル基、NーメチルーNーnープチルカルバモイル基、NーメチルーNーtertーブチルカルバモイル基、NーメチルーNーtertーブチルカルバモイル基、Nーエチルカルバモイル基、NーエチルーNーtertーブチルカルバモイル基、NーエチルーNーtertーブチルカルバモイル基、Nープロピルカモイル基、NーエチルーNーtertーブチルカルバモイル基、NープロピルーNーtertーブチルカルバモイル基、NーイソプロピルーNーtertーブチルカルバモイル基等を挙げることができる。

フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)とは、無置

換のフェニル基並びに上記定義されたハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置 換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ からなる群より選択された置換基を1~5個、好ましくは1~3個有するフェニ ル基であって、例えば、フェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフ 5 エニル基、4ーフルオロフェニル基、2ークロロフェニル基、3ークロロフェニ ル基、4-クロロフェニル基、2-ブロモフェニル基、3-ブロモフェニル基、 4-ブロモフェニル基、2-ヨードフェニル基、3-ヨードフェニル基、4-ヨ ードフェニル基、2、3ージフルオロフェニル基、3、4ージフルオロフェニル 基、3,5-ジフルオロフェニル基、2,4-ジフルオロフェニル基、2,6-ジフルオロフェニル基、2、3ージクロロフェニル基、3、4ージクロロフェニ 10 ル基、3,5-ジクロロフェニル基、2,4-ジクロロフェニル基、2,6-ジ クロロフェニル基、3,4,5ートリフルオロフェニル基、3,4,5ートリク ロロフェニル基、2、4、6ートリフルオロフェニル基、2、4、6ートリクロ ロフェニル基、2-フルオロー4-ブロモフェニル基、4-クロロー3-フルオ ロフェニル基、2、3、4ートリクロロフェニル基、2、3、4ートリフルオロ 15 フェニル基、2, 3, 4, 5, 6 - ペンタフルオロフェニル基、2, 4, 6 - ト リメチルフェニル基、4-n-ブチルフェニル基、2,4-ジメチルフェニル基、 2, 3-ジメチルフェニル基、2, 6-ジメチルフェニル基、3, 5-ジメチル フェニル基、2、5ージメチルフェニル基、3、5ージトリフルオロメチルフェ ニル基、4-n-ブトキシフェニル基、2,4-ジメトキシフェニル基、2,3 20 - ジメトキシフェニル基、2, 6 - ジメトキシフェニル基、3, 5 - ジメトキシ フェニル基、2,5-ジメトキシフェニル基、2,4,6-トリメトキシフェニ ル基、3,5-ジトリフルオロメトキシフェニル基、3-クロロー4-メトキシ フェニル基、2ークロロー4ートリフルオロメトキシフェニル基、3ーメチルー 4-フルオロフェニル基、4-ブロモ-3-トリフルオロメチルフェニル基、2 25ーメチルフェニル基、3ーメチルフェニル基、4ーメチルフェニル基、2ーメチ ルー3ークロロフェニル基、3ーメチルー4ークロロフェニル基、2ークロロー 4-メチルフェニル基、2-メチル-3-フルオロフェニル基、2-トリフルオ ロメチルフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメ

チルフェニル基、2-ペンタフルオロエチルフェニル基、3-ペンタフルオロエ チルフェニル基、4ーペンタフルオロエチルフェニル基、2-イソプロピルフェ ニル基、3-イソプロピルフェニル基、4-イソプロピルフェニル基、2tert-ブチルフェニル基、3-tert-ブチルフェニル基、4-tert ーブチルフェニル基、2-sec-ブチルフェニル基、3-sec-ブチルフェ ニル基、4-secーブチルフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロピルフェ ニル基、3-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-n-ヘプタフルオロ プロピルフェニル基、4ーペンチルフェニル基、4ーヘキシルフェニル基、2-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、4-メトキシフェニル基、3-クロロー2ーメトキシフェニル基、2ーフルオロー3ーメトキシフェニル基、2 10 ーフルオロー4ーメトキシフェニル基、3,4-ジメトキシフェニル基、2ート リフルオロメトキシフェニル基、3-トリフルオロメトキシフェニル基、4-ト リフルオロメトキシフェニル基、3-フルオロ-2-トリフルオロメトキシフェ ニル基、2-フルオロー3-トリフルオロメトキシフェニル基、3-フルオロー 15 4ートリフルオロメトキシフェニル基、3-クロロー2-トリフルオロメトキシ フェニル基、2-クロロー3ートリフルオロメトキシフェニル基、3-クロロー 4-トリフルオロメトキシフェニル基、2-ペンタフルオロエトキシフェニル基、 3-ペンタフルオロエトキシフェニル基、4-ペンタフルオロエトキシフェニル 基、3-クロロ-2-ペンタフルオロエトキシフェニル基、2-クロロ-3-ペ 20 ンタフルオロエトキシフェニル基、3-クロロ-4-ペンタフルオロエトキシフ ェニル基、2-イソプロポキシフェニル基、3-イソプロポキシフェニル基、4 ーイソプロポキシフェニル基、2-tertーブトキシフェニル基、3tertーブトキシフェニル基、4-tertーブトキシフェニル基、2secーブトキシフェニル基、3-secーブトキシフェニル基、4-secー ブトキシフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、3-n-25ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェ ニル基、4-n-ペントキシフェニル基、4-n-ヘキシルオキシフェニル基等 を挙げることができる。

フェニルC1~6アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、

ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未 置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換 されていてもよい)とは、上で定義したハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未 置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキ シ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換されていて もよいフェニルC1~6アルコキシ基とカルボニル基で構成される基であって、 例えば、ベンジルオキシカルボニル基、2-フェニルエトキシカルボニル基、3 - フェニルプロポキシカルボニル基、2-フェニルプロポキシカルボニル基、4 -フェニルブトキシカルボニル基、5-フェニルペントキシカルボニル基、4-フェニルペントキシカルボニル基、6-フェニルヘキシルオキシカルボニル基、 10 2-フルオロベンジルオキシカルボニル基、3-フルオロベンジルオキシカルボ ニル基、4-フルオロベンジルオキシカルボニル基、2-(2-フルオロフェニ ル) エトキシカルボニル基、2-(3-フルオロフェニル) エトキシカルボニル 基、2- (4-フルオロフェニル) エトキシカルボニル基、2-クロロベンジル オキシカルボニル基、3-クロロベンジルオキシカルボニル基、4-クロロベン 15 ジルオキシカルボニル基、2-フルオロ-4-ブロモベンジルオキシカルボニル 基、4-クロロ-3-フルオロベンジルオキシカルボニル基、2,3,4-トリ クロロベンジルオキシカルボニル基、3,4,5-トリフルオロベンジルオキシ カルボニル基、2,3,4,5,6-ペンタフルオロベンジルオキシカルボニル 基、2,4,6-トリクロロベンジルオキシカルボニル基、4-イソプロピルベ 20 ンジルオキシカルボニル基、4-n-ブチルベンジルオキシカルボニル基、4-メチルベンジルオキシカルボニル基、2-メチルベンジルオキシカルボニル基、 3-メチルベンジルオキシカルボニル基、2,4-ジメチルベンジルオキシカル ボニル基、2、3-ジメチルベンジルオキシカルボニル基、2、6-ジメチルベ ンジルオキシカルボニル基、3,5-ジメチルベンジルオキシカルボニル基、2, 25 5-ジメチルベンジルオキシカルボニル基、2,4,6-トリメチルベンジルオ キシカルボニル基、3,5-ジトリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、 4-イソプロポキシベンジルオキシカルボニル基、4-n-ブトキシベンジルオ キシカルボニル基、4-メトキシベンジルオキシカルボニル基、2-メトキシベ

ンジルオキシカルボニル基、3-メトキシベンジルオキシカルボニル基、2,4 -ジメトキシベンジルオキシカルボニル基、2,3-ジメトキシベンジルオキシ カルボニル基、2,6-ジメトキシベンジルオキシカルボニル基、3,5-ジメ トキシベンジルオキシカルボニル基、2,5-ジメトキシベンジルオキシカルボ ニル基、2,4,6-トリメトキシベンジルオキシカルボニル基、3,5-ジト 5 リフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、2-イソプロポキシベンジル オキシカルボニル基、3-クロロー4-メトキシベンジルオキシカルボニル基、 2-クロロー4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、3-メチ ルー4ーフルオロベンジルオキシカルボニル基、4ーブロモー3ートリフルオロ メチルベンジルオキシカルボニル基、2-(2-クロロフェニル)エトキシカル 10 ボニル基、2-(3-クロロフェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-クロ ロフェニル) エトキシカルボニル基、2-トリフルオロメチルベンジルキシカル ボニル基、3-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、4-トリフル オロメチルベンジルオキシカルボニル基、2-トリフルオロメトキシベンジルオ キシカルボニル基、3-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、4 15 ートリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、2-(2-トリフルオロ メチルフェニル) エトキシカルボニル基、2-(3-トリフルオロメチルフェニ ル) エトキシカルボニル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル) エトキシ カルボニル基、2-(2-トリフルオロメトキシフェニル) エトキシカルボニル 基、2-(3-トリフルオロメトキシフェニル)エトキシカルボニル基、2-20 (4-トリフルオロメトキシフェニル) エトキシカルボニル基、3-(2-トリ フルオロメチルフェニル) プロポキシカルボニル基、3-(3-トリフルオロメ チルフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニ ル)プロポキシカルボニル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)プロポ キシカルボニル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェニル)プロポキシカル 25 ボニル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)プロポキシカルボニル基、 4-(3-トリフルオロメチルフェニル)ブトキシカルボニル基、5-(4-ト リフルオロメチルフェニル)ペントキシカルボニル基、4-(4-トリフルオロ メチルフェニル)ペントキシカルボニル基、4-(4-トリフルオロメトキシフ

エニル) ペントキシカルボニル基、6-(3-トリフルオロメチルフェニル) へキシルオキシカルボニル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル) ヘキシルオキシカルボニル基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ヘキシルオキシカルボニル基等を挙げることができる。

フェニルC3~6アルケニルオキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲ 5 ン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基が少なくとも一個置換していてもよ い。)とは、無置換のフェニル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6ア ルキル基からなる群より選ばれた基が1乃至3個置換されたフェニル基と炭素数 3から6で二重結合を1~3個有するアルケニルオキシ基とカルボニル基から構 10 成される基であり、トランス体及びシス体の両者を包含する。このような基とし ては、例えば、3-フェニル-2-プロペニルオキシカルボニル基(慣用名:シ ンナミルオキシカルボニル基)、4-フェニル-2-ブテニルオキシカルボニル 基、4-フェニル-3-ブテニルオキシカルボニル基、5-フェニル-2-ペン テニルオキシカルボニル基、5-フェニル-4-ペンテニルオキシカルボニル基、 5-フェニル-3-ペンテニルオキシカルボニル基、6-フェニル-5-ヘキセ 15 ニルオキシカルボニル基、6-フェニル-4-ヘキセニルオキシカルボニル基、 6-フェニル-3-ヘキセニルオキシカルボニル基、6-フェニル-3-ヘキセ ニルオキシカルボニル基、4-フェニルー1,3-ブタジエニルオキシカルボニ ル基、6-フェニル-1,3,5-ヘキサトリエニルオキシカルボニル基、3-(2ーメチルフェニル) -2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(3-メチ 20 ルフェニル) -2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(4-メチルフェニ ル) -2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(2-トリフルオロメチルフェ ニル) -2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(3-トリフルオロメチルフ ェニル) -2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(4-トリフルオロメチル フェニル) -2-プロペニルオキシカルボニル基、4-(2-トリフルオロメチ 25ルフェニル) -3-ブテニルオキシカルボニル基、4-(3-トリフルオロメチ ルフェニル) -3-ブテニルオキシカルボニル基、4-(4-トリフルオロメチ ルフェニル) -3-ブテニルオキシカルボニル基、3-(3,5-ジトリフルオ

ロメチルフェニル) -2-プロペニルオキシカルボニル基、3-[2,4,6-

挙げることができる。

トリ(トリフルオロメチル)フェニル] - 2 - プロペニルオキシカルボニル基、 3 - (2, 4 - ジメチルフェニル) - 2 - プロペニルオキシカルボニル基等を挙 げることができる。

フェニルC1~6アルキリデン置換アミノ基(フェニル環上には、ハロゲン置 5 換もしくは未置換のC1~6アルキル基が少なくとも一個置換していてもよい) とは、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基が1~3個置換してい てもよいフェニル基が置換したC1~6アルキリデン置換アミノ基であって、例 えば、ベンジリデンアミノ基、2-フェニルエチリデンアミノ基、3-フェニル プロピリデンアミノ基、4ーフェニルブチリデンアミノ基。5ーフェニルペンチ リデンアミノ基、6-フェニルヘキシリデンアミノ基、2-メチルベンジリデン 10 アミノ基、2-トリフルオロメチルベンジリデンアミノ基、3-メチルベンジリ デンアミノ基、3-トリフルオロメチルベンジリデンアミノ基、4-メチルベン ジリデンアミノ基、4-トリフルオロメチルベンジリデンアミノ基、3.4-ジ メチルベンジリデンアミノ基、3,4,5-トリメチルベンジリデンアミノ基、 3,5-ジトリフルオロメチルベンジリデンアミノ基等を挙げることができる。 15 フェノキシ基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6ア ルキル基が少なくとも1個置換していてもよい)とは、無置換のフェノキシ基又 は上記で定義したハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基が1ないし 3個置換したフェノキシ基であって、例えば、フェノキシ基、2-メチルフェノ 20 キシ基、3-メチルフェノキシ基、4-メチルフェノキシ基、2-エチルフェノ キシ基、3-エチルシフェノキシ基、4-エチルフェノキシ基、4-n-プロピ ルフェノキシ基、4-tert-ブチルフェノキシ基、4-n-ブチルフェノキ シ基、2ートリフルオロメチルフェノキシ基、3-トリフルオロメチルフェノキ シ基、4ートリフルオロメチルフェノキシ基、2ーペンタフルオロエチルフェノ キシ基、3ーペンタフルオロエチルフェノキシ基、2、3ージメチルフェノキシ 25 基、3、4、5-トリメチルフェノキシ基、4-n-ペンチルフェノキシ基、4 -n-ヘキシルフェノキシ基、3,5-ジトリフルオロメチルフェノキシ基等を

フェニルアミノ基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~

6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい)とは、無置換のフェニルアミノ基 (別名:アニリノ基) 又は上記で定義したハロゲン置換もしくは未置換の C1~6アルキル基が1ないし3個置換したフェニルアミノ基であって、例えば、フェニルアミノ基、2ーメチルフェニルアミノ基、3ーメチルフェニルアミノ基、4ーメチルフェニルアミノ基、2ーエチルフェニルアミノ基、3ーエチルフェニルアミノ基、4ープロピルフェニルアミノ基、4ーtertーブチルフェニルアミノ基、4ーブチルフェニルアミノ基、2ートリフルオロメチルフェニルアミノ基、3ートリフルオロメチルフェニルアミノ基、2ーペンタフルオロエチルフェニルアミノ基、4ートリフルオロメチルフェニルアミノ基、2ーペンタフルオロエチルフェニルアミノ基、10 アミノ基、3ーペンタフルオロエチルフェニルアミノ基、2,3ージメチルフェニルアミノ基、3,4,5ートリメチルフェニルアミノ基、4ーnーペンチルフェニルアミノ基、4ーnーペキシルフェニルアミノ基、3,5ージトリフルオロメチルフェニルアミノ基、4ーnーペキシルフェニルアミノ基、3,5ージトリフルオロメチルフェニルアミノ基等を挙げることができる。

インドリニル基(インドリン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換 していてもよい)とは、無置換又は2,3,4,5,6又は7位にフッ素原子, 15 塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子が1~3個置換したインドリニル基であって、 例えば、1-インドリニル基、2-フルオロ-1-インドリニル基、3-ブロモ -1-インドリニル基、4,5-ジクロロ-1-インドリニル基、4-フルオロ -1-インドリニル基、4,5,6-トリフルオロ-1-インドリニル基、5-フルオロー1ーインドリニル基、6-フルオロー1ーインドリニル基、7-フル 20 オロー1ーインドリニル基、4ークロロー1ーインドリニル基、5ークロロー1 --インドリニル基、6-クロロ-1-インドリニル基、7-クロロ-1-インド リニル基、4ーブロモー1ーインドリニル基、5ーブロモー1ーインドリニル基、 6-ブロモ-1-インドリニル基、7-ブロモ-1-インドリニル基、4-ヨー ドー1ーインドリニル基、5-ヨードー1ーインドリニル基、6-ヨードー1-25 インドリニル基、7ーヨードー1ーインドリニル基等を挙げることができる。 イソインドリニル基(イソインドリン環上には、少なくとも1個のハロゲン原 子が置換していてもよい)とは、無置換又は1,3,4,5,6又は7位にフッ 素原子、塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子が1~3個置換したイソインドリニ

ル基であって、例えば、2ーイソインドリニル基、1ーフルオロー2ーイソインドリニル基、3ーブロモー2ーイソインドリニル基、4,5ージクロロー2ーイソインドリニル基、4,5ージクロロー2ーイソインドリニル基、4ーフルオロー2ーイソインドリニル基、5ーフルオロー2ーイソインドリニル基、

- 6 ーフルオロー2ーイソインドリニル基、7ーフルオロー2ーイソインドリニル基、4ークロロー2ーイソインドリニル基、5ークロロー2ーイソインドリニル基、6ークロロー2ーイソインドリニル基、7ークロロー2ーイソインドリニル基、4ーブロモー2ーイソインドリニル基、5ーブロモー2ーイソインドリニル基、6ーブロモー2ーイソインドリニル基、7ーブロモー2ーイソインドリニル
 0 基、4ーヨードー2ーイソインドリニル基、5ーヨードー2ーイソインドリニル
- 10 基、4-ョード-2-イソインドリニル基、5-ョード-2-イソインドリニル基、6-ョード-2-イソインドリニル基、7-ョード-2-イソインドリニル基等を挙げることができる。

1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル基(1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい)とは、

- 15 無置換又は2,3,4,5,6,7又は8位にフッ素原子、塩素原子、臭素原子 又はヨウ素原子が $1\sim3$ 個置換した1,2,3,4-テトラヒドロキノリル基で あって、例えば、1,2,3,4-テトラヒドロ-1-キノリル基、5-フルオ ロ-1,2,3,4-テトラヒドロ-1-キノリル基、2-ブロモ-1,2,3, 4-テトラヒドロ-1-キノリル基、3-ヨード-1,2,3,4-テトラヒド
- 20 ロー1ーキノリル基、4ークロロー1, 2, 3, 4ーテトラヒドロー1ーキノリル基、3, 4ージクロロー1, 2, 3, 4ーテトラヒドロー1ーキノリル基、4, 5, 6ートリクロロー1, 2, 3, 4ーテトラヒドロー1ーキノリル基、6ーフルオロー1, 2, 3, 4ーテトラヒドロー1ーキノリル基、7ーフルオロー1, 2, 3, 4ーテトラヒドロー1ーキノリル基、8ーフルオロー1, 2, 3, 4ー
- 25 テトラヒドロー1ーキノリル基、5ークロロー1, 2, 3, 4ーテトラヒドロー 1ーキノリル基、6ークロロー1, 2, 3, 4ーテトラヒドロー1ーキノリル基、 7ークロロー1, 2, 3, 4ーテトラヒドロー1ーキノリル基、8ークロロー1, 2, 3, 4ーテトラヒドロー1ーキノリル基、5ープロモー1, 2, 3, 4ーテトラヒドロー1

ーキノリル基、7ーブロモー1, 2, 3, 4ーテトラヒドロー1ーキノリル基、8ーブロモー1, 2, 3, 4ーテトラヒドロー1ーキノリル基、5ーヨードー1, 2, 3, 4ーテトラヒドロー1ーキノリル基、6ーヨードー1, 2, 3, 4ーテトラヒドロー1ーキノリル基、7ーヨードー1, 2, 3, 4ーテトラヒドロー1 ーキノリル基、8ーヨードー1, 2, 3, 4ーテトラヒドロー1ーキノリル基等を挙げることができる。

1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリニル基(1, 2, 3, 4-テトラヒ ドロイソキノリン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよ い)を示す。)とは、無置換又は1,3,4,5,6,7又は8位にフッ素原子、 塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子が1~3個置換した1,2,3,4ーテトラ 10 ヒドロイソキノリル基であって、例えば、1,2,3,4ーテトラヒドロー2-イソキノリル基、1-ブロモ-1,2,3,4-テトラヒドロ-2-イソキノリ ル基、3-ヨード-1,2,3,4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、4-クロロー1, 2, 3, 4ーテトラヒドロー2ーイソキノリル基、3, 4ージクロ ロー1, 2, 3, 4ーテトラヒドロー2ーイソキノリル基、4, 5, 6ートリク 15 ロロー1, 2, 3, 4ーテトラヒドロー2ーイソキノリル基、5ーフルオロー1, 2, 3, 4ーテトラヒドロー2ーイソキノリル基、6ーフルオロー1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、7-フルオロ-1,2,3,4-テト ラヒドロー2ーイソキノリル基、8ーフルオロー1,2,3,4ーテトラヒドロ -2-イソキノリル基、5-クロロ-1,2,3,4-テトラヒドロ-2-イソ 20 キノリル基、6-クロロ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、 7-クロロ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、8-クロロ -1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、5-ブロモ-1, 2, 3, 4ーテトラヒドロー2ーインキノリル基、6ーブロモー1, 2, 3, 4ーテ 25

25 トラヒドロー2ーイソキノリル基、7ーブロモー1, 2, 3, 4ーテトラヒドロ ー2ーイソキノリル基、8ーブロモー1, 2, 3, 4ーテトラヒドロー2ーイソ キノリル基、5ーヨードー1, 2, 3, 4ーテトラヒドロー2ーイソキノリル基、 6ーヨードー1, 2, 3, 4ーテトラヒドロー2ーイソキノリル基、7ーヨード ー1, 2, 3, 4ーテトラヒドロー2ーイソキノリル基、8ーヨードー1, 2, 3, 4ーテトラヒドロー2ーイソキノリル基、等を挙げることができる。

フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子;ハロゲン笸 換もしくは未置換のC1~6アルキル基;ハロゲン置換もしくは未置換のC1~ 6アルコキシ基及びフェノキシ基[フェニル環上には、置換基としてハロゲン原 - 子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしく は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が 置換していてもよい]からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換してい てもよい。また、C1~6アルキル部分には、C1~6アルコキシイミノ基が置 換していてもよい。)とは、無置換のフェニル基又はハロゲン原子、ハロゲン置 換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~ 10 6アルコキシ基及びフェノキシ基[フェニル環上には、置換基としてハロゲン原 子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしく は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~3個置換して いてもよい〕からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換し たフェニル基と炭素数1乃至6個のアルキル基で構成される基であって、例えば、 15 ベンジル基、1-フェネチル基、2-フェネチル基、3-フェニルプロピル基、 2-フェニルプロピル基、4-フェニルブチル基、5-フェニルペンチル基、4 -フェニルペンチル基、6-フェニルヘキシル基、2-フルオロベンジル基、3 ーフルオロベンジル基、4ーフルオロベンジル基、2ークロロベンジル基、3ー クロロベンジル基、4-クロロベンジル基、2-ブロモベンジル基、3-ブロモ 20 ベンジル基、4ーブロモベンジル基、2ーヨードベンジル基、3ーヨードベンジ ル基、4-ヨードベンジル基、2、3-ジフルオロベンジル基、3、4-ジフル オロベンジル基、3,5-ジフルオロベンジル基、2,4-ジフルオロベンジル 基、2、6-ジフルオロベンジル基、2、3-ジクロロベンジル基、3、4-ジ クロロベンジル基、3,5-ジクロロベンジル基、2,4-ジクロロベンジル基、 25 2、6-ジクロロベンジル基、2-フルオロ-4-ブロモベンジル基、4-クロ ロー3-フルオロベンジル基、2、3、4-トリクロロベンジル基、3、4、5 ートリフルオロベンジル基、2,3,4,5,6-ペンタフルオロベンジル基、 2.4.6-トリクロロベンジル基、4-イソプロピルベンジル基、4-n-ブ

チルベンジル基、4-メチルベンジル基、2-メチルベンジル基、3-メチルベ ンジル基、2,4-ジメチルベンジル基、2,3-ジメチルベンジル基、2,6 -ジメチルベンジル基、3,5-ジメチルベンジル基、2,5-ジメチルベンジ ル基、2,4,6-トリメチルベンジル基、3,5-ジトリフルオロメチルベン ジル基、4-イソプロポキシベンジル基、4-n-ブトキシベンジル基、4-メ トキシベンジル基、2-メトキシベンジル基、3-メトキシベンジル基、2,4 --ジメトキシベンジル基、2、3-ジメトキシベンジル基、2、6-ジメトキシ ベンジル基、3、5-ジメトキシベンジル基、2、5-ジメトキシベンジル基、 2, 4, 6-トリメトキシベンジル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシベンジ 10 ル基、2-イソプロポキシベンジル基、3-クロロ-4-メトキシベンジル基、 2-クロロ-4-トリフルオロメトキシベンジル基、3-メチル-4-フルオロ ベンジル基、4ーブロモー3ートリフルオロメチルベンジル基、2ートリフルオ ロメチルベンジル基、3-トリフルオロメチルベンジル基、4-トリフルオロメ チルベンジル基、2-ペンタフルオロエチルベンジル基、3-ペンタフルオロエ チルベンジル基、4ーペンタフルオロエチルベンジル基、2ートリフルオロメト 15 キシベンジル基、3-トリフルオロメトキシベンジル基、4-トリフルオロメト キシベンジル基、2-ペンタフルオロエトキシベンジル基、3-ペンタフルオロ エトキシベンジル基、4-ペンタフルオロエトキシベンジル基、2-(2-トリ フルオロメチルフェニル) エチル基、2-(3-トリフルオロメチルフェニル) エチル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(2-トリ 20 フルオロメトキシフェニル) エチル基、2-(3-トリフルオロメトキシフェニ ル) エチル基、2- (4-トリフルオロメトキシフェニル) エチル基、2- (2 ーペンタフルオロエトキシフェニル) エチル基、2-(3-ペンタフルオロエト キシフェニル) エチル基、2- (4-ペンタフルオロエトキシフェニル) エチル 基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(3-トリフル 25 オロメチルフェニル)プロピル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プ ロピル基、3-(2-トリフルオロメトキシフェニル)プロピル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェニル)プロピル基、3-(4-トリフルオロメトキシ フェニル)プロピル基、3-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)プロピル

基、3-(4-ペンタフルオロエトキシフェニル)プロピル基、4-(3-ペン タフルオロエトキシフェニル)ブチル基、5-(4-トリフルオロメチルフェニ ル) ペンチル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル) ペンチル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ペンチル基、6-(3-トリフルオロメ チルフェニル)へキシル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル)へキシル 基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル)へキシル基、(4-ペンタフル オロエトキシフェニル)プロピル基、4-(3-ペンタフルオロエトキシフェニ ル) ブチル基、5-(4-トリフルオロメチルフェニル) ペンチル基、4-(4 --トリフルオロメチルフェニル)ペンチル基、4-(4-トリフルオロメトキシ フェニル)ペンチル基、6-(3-トリフルオロメチルフェニル)へキシル基、 10 6-(4-トリフルオロメチルフェニル) ヘキシル基、6-(4-トリフルオロ メトキシフェニル)ヘキシル基、3-フェノキシベンジル基、4-フェノキシベ ンジル基、2-(4-フェノキシフェニル)エチル基、3-(4-フェノキシフ ェニル)プロピル基、2-(4-フェノキシフェニル)プロピル基、4-(4-フェノキシフェニル)ブチル基、5-(4-フェノキシフェニル)ペンチル基、 4-(4-フェノキシフェニル)ペンチル基、6-(4-フェノキシフェニル) ヘキシル基、2-フェノキシベンジル基、2-(3-フェノキシフェニル) エチ ル基、3-(2-フェノキシフェニル)プロピル基、2-(2-フェノキシフェ ニル)プロピル基、4-(3-フェノキシフェニル)ブチル基、5-(2-フェ 20 ノキシフェニル)ペンチル基、4-(3-フェノキシフェニル)ペンチル基、6 - (3-フェノキシフェニル) ヘキシル基、4-(2-クロロフェノキシ) ベン ジル基、4-(3-クロロフェノキシ)ベンジル基、4-(4-クロロフェノキ シ)ベンジル基、4-(2-トリフルオロメチルフェノキシ)ベンジル基、4-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)ベンジル基、4-(4-トリフルオロメ チルフェノキシ)ベンジル基、4-(2-トリフルオロメトキシフェノキシ)ベ 25 ンジル基、4-(3-トリフルオロメトキシフェノキシ)ベンジル基、4-(4 ートリフルオロメトキシフェノキシ) ベンジル基、2- [4-(4-クロロフェ ノキシ)フェニル]エチル基、2-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキ シ)フェニル]エチル基、3-[4-(4-クロロフェノキシ)フェニル]プロ

ピル基、3-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル] プロピル 基、3-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル]プロピル基、 2- [4-(4-クロロフェノキシ) フェニル] プロピル基、4-[4-(4-クロロフェノキシ)フェニル]ブチル基、4-[4-(4-トリフルオロメチル フェノキシ)フェニル]ブチル基、4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェ ノキシ)フェニル]ブチル基、5-[4-(4-クロロフェノキシ)フェニル] ペンチル基、4-[4-(4-クロロフェノキシ)フェニル]ペンチル基、6-[4-(4-クロロフェノキシ)フェニル]へキシル基、6-[4-(4-トリ フルオロメチルフェノキシ)フェニル]ヘキシル基、6-[4-(4-トリフル 10 オロメトキシフェノキシ)フェニル]ヘキシル基、(2-フルオロー4-ブロモ フェノキシ)ベンジル基、(4-クロロ-3-フルオロフェノキシ)ベンジル基、 (2、3、4-トリクロロフェノキシ) ベンジル基、(3,4,5-トリフルオ ロフェノキシ) ベンジル基、(2,4,6-トリクロロフェノキシ) ベンジル基、 (4-イソプロピルフェノキシ) ベンジル基、(4-n-ブチルフェノキシ) ベ ンジル基、(4-メチルフェノキシ)ベンジル基、(2-メチルフェノキシ)ベ 15 ンジル基、(3-メチルフェノキシ)ベンジル基、(2,4-ジメチルフェノキ シ) ベンジル基、(2,3-ジメチルフェノキシ) ベンジル基、(2,6-ジメ チルフェノキシ)ベンジル基、(3,5-ジメチルフェノキシ)ベンジル基、 (2、5-ジメチルフェノキシ) ベンジル基、(2,4,6-トリメチルフェノ 20 キシ) ベンジル基、(3,5-ジトリフルオロメチルフェノキシ) ベンジル基、 (4-イソプロポキシフェノキシ)ベンジル基、(4-n-ブトキシフェノキ シ) ベンジル基、(4-メトキシフェノキシ) ベンジル基、(2-メトキシフェ ノキシ) ベンジル基、 (3-メトキシフェノキシ) ベンジル基、 (2, 4-ジメ トキシフェノキシ)ベンジル基、(2,3-ジメトキシフェノキシ)ベンジル基、 (2,6-ジメトキシフェノキシ)ベンジル基、(3,5-ジメトキシフェノキ 25 シ) ベンジル基、(2,5-ジメトキシフェノキシ) ベンジル基、(2,4,6 --トリメトキシフェノキシ)ベンジル基、(3,5-ジトリフルオロメトキシフ ェノキシ)ベンジル基、(2-イソプロポキシフェノキシ)ベンジル基、(3-クロロー4ーメトキシフェノキシ)ベンジル基、(2-クロロー4ートリフルオ

ロメトキシフェノキシ) ベンジル基、(3-メチル-4-フルオロフェノキシ) ベンジル基、(4-ブロモ-3-トリフルオロメチルフェノキシ) ベンジル基等 を挙げることができる。

ベンゾイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置 換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基 からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、 例えば、ベンゾイル基、2-フルオロベンゾイル基、3-フルオロベンゾイル基、 4-フルオロベンゾイル基、2,3-ジフルオロベンゾイル基、2,3,4,5, 6-ペンタフルオロベンゾイル基、3,4-ジフルオロベンゾイル基、2-クロ 10 - ロベンゾイル基、3ークロロベンゾイル基、4ークロロベンゾイル基、2.3-ジクロロベンゾイル基、3,4-ジクロロベンゾイル基、2-ブロモベンゾイル 基、3ーブロモベンゾイル基、4ーブロモベンゾイル基、2、3ージブロモベン ゾイル基、3,4-ジブロモベンゾイル基、2-フルオロ-4-ブロモベンゾイ ル基、4-クロロー3-フルオロベンゾイル基、2,3,4-トリフルオロベン - ゾイル基、2,4,6-トリクロロベンゾイル基、4-イソプロピルベンゾイル 15 基、4-n-ブチルベンゾイル基、2,4-ジメチルベンゾイル基、2,3-ジ メチルベンゾイル基、2,6-ジメチルベンゾイル基、3,5-ジメチルベンゾ イル基、2,5-ジメチルベンゾイル基、2,4,6-トリメチルベンゾイル基、 3, 5-ジトリフルオロメチルベンゾイル基、4-n-ブトキシベンゾイル基、 20 2, 4-ジメトキシベンゾイル基、2, 3-ジメトキシベンゾイル基、2, 6-ジメトキシベンゾイル基、3,5-ジメトキシベンゾイル基、2,5-ジメトキ シベンゾイル基、3,5-ジトリフルオロメトキシベンゾイル基、3-クロロー 4-メトキシベンゾイル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシベンゾイル 基、3-メチルー4ーフルオロベンゾイル基、4ーブロモー3ートリフルオロメ チルベンゾイル基、2-メチルベンゾイル基、3-メチルベンゾイル基、4-メ チルベンゾイル基、3,4ージメチルベンゾイル基、2ーヨードベンゾイル基、 3-ヨードベンゾイル基、4-ヨードベンゾイル基、2-トリフルオロメチルベ ンゾイル基、3-トリフルオロメチルベンゾイル基、4-トリフルオロメチルベ

ンゾイル基、2,3-ジトリフルオロメチルベンゾイル基、3,4-ジトリフル

オロメチルベンゾイル基、2-メトキシベンゾイル基、3-メトキシベンゾイル基、3-メトキシベンゾイル基、2-トリフルオロメトキシベンゾイル基、3-トリフルオロメトキシベンゾイル基等のベンゾイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置りからなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換してもよい)を挙げることができる。

ピリジル基 (ピリジン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換してい てもよい)としては、例えば、2-ピリジル基、3-ピリジル基、4-ピリジル 基、2-クロロピリジン-3-イル基、2-クロロピリジン-4-イル基、2-10 クロロピリジン-5-イル基、5-クロロピリジン-2-イル基、4-クロロピ リジンー2ーイル基、3ークロロピリジンー2ーイル基、2ーフルオロピリジン - 3-イル基、2-フルオロピリジン-4-イル基、2-フルオロピリジン-5 ーイル基、5-フルオロピリジン-2-イル基、4-フルオロピリジン-2-イ 15 ル基、3-フルオロピリジン-2-イル基、2-ブロモピリジン-3-イル基、 2-ブロモピリジン-4-イル基、2-ブロモピリジン-5-イル基、5-ブロ モピリジンー2ーイル基、4ーブロモピリジンー2ーイル基、3ーブロモピリジ ン-2-イル基、2-ブロモ-4-クロロピリジン-4-イル基、2,6-ジク ロロピリジン-4-イル基、2,4,6-トリクロロピリジン-3-イル等のピ リジル基 (ピリジン環上には、1~3個のハロゲン原子が置換していてもよい) 20 を挙げることができる。

フェノキシC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン 置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していても よい)とは、無置換のフェノキシ基又は上記で定義したハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ 基及びハロゲンからなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換したフェノキシ基とC1~6アルキル基で構成される基であって、例えば、フェノキシメチル基、2-フェノキシエチル基、3-フェノキシプロピル基、4-フ

ェノキシブチル基、5-フェノキシペンチル基、6-フェノキシヘキシル基、4 -フルオロフェノキシメチル基、2-フルオロ-4-ブロモフェノキシメチル基、 4-クロロー3-フルオロフェノキシメチル基、2,3,4-トリクロロフェノ キシメチル基、3,4,5ートリクロロフェノキシメチル基、2,4,6ートリ クロロフェノキシメチル基、4-イソプロピルフェノキシメチル基、4-n-ブ チルフェノキシメチル基、4-メチルフェノキシメチル基、2-メチルフェノキ シメチル基、3-メチルフェノキシメチル基、2,4-ジメチルフェノキシメチ ル基、2, 3-ジメチルフェノキシメチル基、2, 6-ジメチルフェノキシメチ ル基、3, 5-ジメチルフェノキシメチル基、2, 5-ジメチルフェノキシメチ ル基、2,4,6-トリメチルフェノキシメチル基、3,5-ジトリフルオロメ 10 チルフェノキシメチル基、2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェノキシメチ ル基、4ーイソプロポキシフェノキシメチル基、4-n-ブトキシフェノキシメ チル基、4-メトキシフェノキシメチル基、2-メトキシフェノキシメチル基、 3ーメトキシフェノキシメチル基、2、4ージメトキシフェノキシメチル基、2、 15 3ージメトキシフェノキシメチル基、2,6ージメトキシフェノキシメチル基、 3, 5-ジメトキシフェノキシメチル基、2, 5-ジメトキシフェノキシメチル 基、2,4,6-トリメトキシフェノキシメチル基、3,5-ジトリフルオロメ トキシフェノキシメチル基、2-イソプロポキシフェノキシメチル基、3-クロ ロー4ーメトキシフェノキシメチル基、2-クロロー4-トリフルオロメトキシ フェノキシメチル基、3-メチル-4-フルオロフェノキシメチル基、4-ブロ 20 モー3-トリフルオロメチルフェノキシメチル基、2-(4-フルオロフェノキ シ) エチル基、3-(4-フルオロフェノキシ) プロピル基、4-(4-フルオ ロフェノキシ) ブチル基、5-(4-フルオロフェノキシ) ペンチル基、6-(4-フルオロフェノキシ)ヘキシル基、4-クロロフェノキシメチル基、2-(4-クロロフェノキシ)エチル基、3-(4-クロロフェノキシ)プロピル基、 25 4- (4-クロロフェノキシ) ブチル基、5- (4-クロロフェノキシ) ペンチ ル基、6-(4-クロロフェノキシ) ヘキシル基、4-メチルフェノキシメチル 基、2-(4-メチルフェノキシ)エチル基、3-(4-メチルフェノキシ)プ ロピル基、4-(4-メチルフェノキシ)ブチル基、5-(4-メチルフェノキ

シ)ペンチル基、6-(4-メチルフェノキシ)へキシル基、4ートリフルオロメチルフェノキシメチル基、2-(4ートリフルオロメチルフェノキシ)エチル基、3-(4ートリフルオロメチルフェノキシ)プロピル基、4-(4ートリフルオロメチルフェノキシ)ブチル基、5-(4ートリフルオロメチルフェノキシ)ブチル基、5-(4ートリフルオロメチルフェノキシ)ペンチル基、6-(4ートリフルオロメチルフェノキシ)へキシル基、4ートリフルオロメトキシフェノキシ)エチル基、3-(4ートリフルオロメトキシフェノキシ)プロピル基、4-(4ートリフルオロメトキシフェノキシ)ブチル基、5-(4ートリフルオロメトキシフェノキシ)ペンチル基、6-(4ートリフルオロメトキシフェノキシ)プロピル基、3-(4ーメトキシフェノキシ)プロピル基、4-(4ーメトキシフェノキシ)ブチル基、5-(4ーメトキシフェノキシ)プロピル基、4-(4ーメトキシフェノキシ)ブチル基、5-(4ーメトキシフェノキシ)ペンチル基、6-(4ーメトキシフェノキシ)へキシル基等を挙げることができる。

ベンゾイルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン 置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1 15 ~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していても よい)としては、例えば、ベンゾイルメチル基、2-ベンゾイルエチル基、1-ベンゾイルエチル基、3-ベンゾイルプロピル基、4-ベンゾイルブチル基、5 ーベンゾイルペンチル基、6ーベンゾイルへキシル基、2ーメチルー3ーベンゾ イルプロピル基、1、1-ジメチル-2-ベンゾイルエチル基、2-フルオロベ 20 ンゾイルメチル基、3-フルオロベンゾイルメチル基、4-フルオロベンゾイル メチル基、2-クロロベンゾイルメチル基、3-クロロベンゾイルメチル基、4 –クロロベンゾイルメチル基、2ーブロモベンゾイルメチル基、3ーブロモベン ゾイルメチル基、4ーブロモベンゾイルメチル基、2ーフルオロー4ーブロモベ ンゾイルメチル基、4-クロロ-3-フルオロベンゾイルメチル基、2,3,4 25 - トリクロロベンゾイルメチル基、2、4、6-トリクロロベンゾイルメチル基、 4-イソプロピルベンゾイルメチル基、4-n-ブチルベンゾイルメチル基、2, 4-ジメチルベンゾイルメチル基、2,3-ジメチルベンゾイルメチル基、2, 6-ジメチルベンゾイルメチル基、3,5-ジメチルベンゾイルメチル基、2,

5-ジメチルベンゾイルメチル基、2,4,6-トリメチルベンゾイルメチル基、3,5-ジトリフルオロメチルベンゾイルメチル基、2,3,4,5,6-ペンタフルオロベンゾイルメチル基、4-n-ブトキシベンゾイルメチル基、2,4-ジメトキシベンゾイルメチル基、2,3-ジメトキシベンゾイルメチル基、

- 2,6-ジメトキシベンゾイルメチル基、3,5-ジメトキシベンゾイルメチル基、2,5-ジメトキシベンゾイルメチル基、3,5-ジトリフルオロメトキシベンゾイルメチル基、3-クロロー4-メトキシベンゾイルメチル基、2-クロロー4-トリフルオロメトキシベンゾイルメチル基、3-メチルー4-フルオロベンゾイルメチル基、4-ブロモー3-トリフルオロメチルベンゾイルメチル基、
- 10 2ートリフルオロメチルベンゾイルメチル基、3ートリフルオロメチルベンゾイルメチル基、4ートリフルオロメチルベンゾイルメチル基、2ートリフルオロメトキシベンゾイルメチル基、4ートリフルオロメトキシベンゾイルメチル基、4ートリフルオロメトキシベンゾイルメチル基、2ー(2ーフルオロベンゾイル)エチル基、2ー(3ーフルオロベンゾイル)エチル基、2ー(4ーフルオロベン
- 15 ゾイル)エチル基、2-(2-クロロベンゾイル)エチル基、2-(3-クロロベンゾイル)エチル基、2-(4-クロロベンゾイル)エチル基、2-(2-ブロモベンゾイル)エチル基、2-(4-ブロモベンゾイル)エチル基、2-(4-ブロモベンゾイル)エチル基、2-(2-トリフルオロメチルベンゾイル)エチル基、2-(3-トリフルオロメチルベンゾイル)エチル基、2-(4-トリアル基、2-(3-トリフルオロメチルベンゾイル)エチル基、2-(4-トリアル
- 20 フルオロメチルベンゾイル)エチル基、2-(2-トリフルオロメトキシベンゾイル)エチル基、2-(3-トリフルオロメトキシベンゾイル)エチル基、2-(4-トリフルオロメトキシベンゾイル)エチル基、3-(2-クロロベンゾイル)プロピル基、3-(4-クロロベンゾイル)プロピル基、3-(4-クロロベンゾイル)プロピル基、3-(2-トリフルオロメチルベンゾイル)プロピル
- 25 基、3-(3-トリフルオロメチルベンゾイル)プロピル基、3-(4-トリフルオロメチルベンゾイル)プロピル基、3-(2-トリフルオロメトキシベンゾイル)プロピル基、3-(3-トリフルオロメトキシベンゾイル)プロピル基、3-(4-トリフルオロメトキシベンゾイル)プロピル基、4-(2-クロロベンゾイル)ブチル基、4-(4-クロ

ロベンゾイル)ブチル基、4-(2-トリフルオロメチルベンゾイル)ブチル基、 4-(3-トリフルオロメチルベンゾイル)ブチル基、4-(4-トリフルオロ メチルベンゾイル) ブチル基、4-(2-トリフルオロメトキシベンゾイル) ブ チル基、4-(3-トリフルオロメトキシベンゾイル)ブチル基、4-(4-ト リフルオロメトキシベンゾイル) ブチル基、5-(2-クロロベンゾイル) ペン チル基、5-(3-クロロベンゾイル)ペンチル基、5-(4-クロロベンゾイ ル)ペンチル基、5-(2-トリフルオロメチルベンゾイル)ペンチル基、5-(3-トリフルオロメチルベンゾイル)ペンチル基、5-(4-トリフルオロメ チルベンゾイル)ペンチル基、5-(2-トリフルオロメトキシベンゾイル)ペ ンチル基、5-(3-トリフルオロメトキシベンゾイル)ペンチル基、5-(4 10 --トリフルオロメトキシベンゾイル)ペンチル基、6-(2-クロロベンゾイ ル) ヘキシル基、6-(3-クロロベンゾイル) ヘキシル基、6-(4-クロロ ベンゾイル) ヘキシル基、6-(2-トリフルオロメチルベンゾイル) ヘキシル 基、6-(3-トリフルオロメチルベンゾイル)へキシル基、6-(4-トリフ ルオロメチルベンゾイル) ヘキシル基、6-(2-トリフルオロメトキシベンゾ 15 イル) ヘキシル基、6-(3-トリフルオロメトキシベンゾイル) ヘキシル基、 6-(4-トリフルオロメトキシベンゾイル) ヘキシル基等のベンゾイルС1~ 6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基か らなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい) 20 を挙げることができる。

フェノキシ基(フェニル環上には、ハロゲン原子;ハロゲン置換もしくは未置 換のC1~6アルキル基;ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ 基;C1~4アルキレンジオキシ基;C1~6アルコキシカルボニル基;シアノ 25 基;C2~6アルケニル基;ニトロ基;フェニル基;置換基としてフェニル基、 C1~6アルキル基、カルバモイル基及びC1~6アルカノイル基からなる群よ り選ばれた基を有することのあるアミノ基;C1~6アルカノイル置換C1~6 アルキル基;水酸基;C1~6アルコキシカルボニル置換C1~6アルキル基; フェニルC1~6アルキル基;C1~6アルカノイル基;C1~6アルキルチオ

基;1,2,4-トリアゾリル基;イソオキサゾリル基;イミダゾリル基;ベン ゾチアゾリル基;2H-ベンゾトリアゾリル基;ピロリル基;ベンゾオキサゾリ ル基;ピペラジニル基[ピペラジン環上には、置換基としてC1~6アルコキシ カルボニル基及びフェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原 5 子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換 のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換して いてもよい)からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよ い];ピペリジル基[ピペリジン環上には、少なくとも1個のアミノ基が置換し ていてもよい。該アミノ基上には置換基としてC1~6アルキル基及びフェニル 基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アル 10 キル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ば れた基の少なくとも1種が置換していてもよい)からなる群より選ばれた基の少 なくとも1種が置換していてもよい。]及びカルバモイル基からなる群より選ば れた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、フェノキシ 基、2-フルオロフェノキシ基、3-フルオロフェノキシ基、4-フルオロフェ 15 ノキシ基、2-クロロフェノキシ基、3-クロロフェノキシ基、4-クロロフェ ノキシ基、2-ブロモフェノキシ基、3-ブロモフェノキシ基、4-ブロモフェ ノキシ基、2-ヨードフェノキシ基、3-ヨードフェノキシ基、4-ヨードフェ ノキシ基、2、3-ジフルオロフェノキシ基、3、4-ジフルオロフェノキシ基、 3、5-ジフルオロフェノキシ基、2、4-ジフルオロフェノキシ基、2、6-20 ジフルオロフェノキシ基、2、3-ジクロロフェノキシ基、3,4-ジクロロフ ェノキシ基、3,5-ジクロロフェノキシ基、2,4-ジクロロフェノキシ基、 2, 6-ジクロロフェノキシ基、2, 3, 4-トリフルオロフェノキシ基、3, 4, 5-トリフルオロフェノキシ基、3, 4, 5-トリクロロフェノキシ基、2, 4、6-トリフルオロフェノキシ基、2、3、4、5、6ーペンタフルオロフェ 25 ノキシ基、2、4、6-トリクロロフェノキシ基、2-フルオロー4-クロロフ ェノキシ基、2-フルオロー4-ブロモフェノキシ基、3-フルオロー4-クロ ロフェノキシ基、2ーメチルフェノキシ基、3ーメチルフェノキシ基、4ーメチ ルフェノキシ基、2,6-ジメチルフェノキシ基、2,4,6-トリメチルフェ

ノキシ基、2-メチルー3-クロロフェノキシ基、3-メチルー4-クロロフェ ノキシ基、2-クロロー4-メチルフェノキシ基、2-メチルー3-フルオロフ ェノキシ基、2-トリフルオロメチルフェノキシ基、3-トリフルオロメチルフ ェノキシ基、4ートリフルオロメチルフェノキシ基、3,5ージ(トリフルオロ - メチル) フェノキシ基、3,4-ジ(トリフルオロメチル)フェノキシ基、2, 4-ジ(トリフルオロメチル)フェノキシ基、2-ペンタフルオロエチルフェノ キシ基、3-ペンタフルオロエチルフェノキシ基、4-ペンタフルオロエチルフ ェノキシ基、2-イソプロピルフェノキシ基、3-イソプロピルフェノキシ基、 4-イソプロピルフェノキシ基、2-tert-ブチルフェノキシ基、3-te r t - ブチルフェノキシ基、4ーtert-ブチルフェノキシ基、2-sec-10 ブチルフェノキシ基、3-sec-ブチルフェノキシ基、4-sec-ブチルフ ェノキシ基、4-n-ブチルフェノキシ基、4-n-ペンチルフェノキシ基、4 - n - ヘキシルフェノキシ基、2-n-ヘプタフルオロプロピルフェノキシ基、 3-n-ヘプタフルオロプロピルフェノキシ基、4-n-ヘプタフルオロプロピ ルフェノキシ基、4ーペンチルフェノキシ基、4ーヘキシルフェノキシ基、2ー 15 メトキシフェノキシ基、3-メトキシフェノキシ基、4-メトキシフェノキシ基、 2-メトキシー3-クロロフェノキシ基、2-フルオロー3-メトキシフェノキ シ基、2-フルオロー4-メトキシフェノキシ基、2-フルオロー4-ブロモフ ェノキシ基、2、4ージメチルフェノキシ基、2、3ージメチルフェノキシ基、 3.5-ジメチルフェノキシ基、2,5-ジメチルフェノキシ基、4-イソプロ 20 ポキシフェノキシ基、4-n-ブトキシフェノキシ基、2,4-ジメトキシフェ ノキシ基、2.3-ジメトキシフェノキシ基、3,5-ジメトキシフェノキシ基、 2. 5 - ジメトキシフェノキシ基、2, 4, 6 - トリメトキシフェノキシ基、3, 5-ジトリフルオロメトキシフェノキシ基、2-イソプロポキシフェノキシ基、 3-クロロー4-メトキシフェノキシ基、2-クロロー4-トリフルオロメトキ 25シフェノキシ基、3ーメチルー4ーフルオロフェノキシ基、4ーブロモー3ート リフルオロメチルフェノキシ基、2、6-ジメトキシフェノキシ基、2-トリフ ルオロメトキシフェノキシ基、3ートリフルオロメトキシフェノキシ基、4ート

リフルオロメトキシフェノキシ基、2、3-ジ(トリフルオロメトキシ)フェノ

キシ基、3,5-ジ(トリフルオロメトキシ)フェノキシ基、2,4-ジ(トリ フルオロメトキシ)フェノキシ基、2-ペンタフルオロエトキシフェノキシ基、 3-ペンタフルオロエトキシフェノキシ基、4-ペンタフルオロエトキシフェノ キシ基、3-イソプロポキシフェノキシ基、2-tert-ブトキシフェノキシ 基、3-tert-ブトキシフェノキシ基、4-tert-ブトキシフェノキシ 基、2-sec-ブトキシフェノキシ基、3-sec-ブトキシフェノキシ基、 4-sec-ブトキシフェノキシ基、4-n-ヘキシルオキシフェノキシ基、2 - n - ヘプタフルオロプロポキシフェノキシ基、3-n-ヘプタフルオロプロポ キシフェノキシ基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェノキシ基、2,3-メチレンジオキシフェノキシ基、3,4-メチレンジオキシフェノキシ基、2, 10 3-エチレンジオキシフェノキシ基、3,4-エチレンジオキシフェノキシ基、 2-メトキシカルボニルフェノキシ基、3-メトキシカルボニルフェノキシ基、 4-メトキシカルボニルフェノキシ基、2-エトキシカルボニルフェノキシ基、 3-エトキシカルボニルフェノキシ基、4-エトキシカルボニルフェノキシ基、 4ープロポキシカルボニルフェノキシ基、4ーブトキシカルボニルフェノキシ基、 15 4-ペントキシカルボニルフェノキシ基、4-ヘキシルオキシカルボニルフェノ キシ基、2-シアノフェノキシ基、3-シアノフェノキシ基、4-シアノフェノ キシ基、2,3-ジシアノフェノキシ基、2,4,6-トリシアノフェノキシ基、 2-ビニルフェノキシ基、3-ビニルフェノキシ基、4-ビニルフェノキシ基、 2-アリルフェノキシ基、3-アリルフェノキシ基、4-アリルフェノキシ基、 20 2-(3-ブテニル)フェノキシ基、3-(3-ブテニル)フェノキシ基、4-(3-ブテニル)フェノキシ基、2-(4-ペンテニル)フェノキシ基、3-(4ーペンテニル)フェノキシ基、4-(4-ペンテニル)フェノキシ基、2-(5-ヘキセニル)フェノキシ基、3-(5-ヘキセニル)フェノキシ基、4-25 (5-ヘキセニル)フェノキシ基、2-ニトロフェノキシ基、3-ニトロフェノ キシ基、4-ニトロフェノキシ基、2、3-ジニトロフェノキシ基、2、4-ジ ニトロフェノキシ基、2,4,6-トリニトロフェノキシ基、2ービフェニリル オキシ基、3-ビフェニリルオキシ基、4-ビフェニリルオキシ基、2-ジょチ ルアミノフェノキシ基、3ージメチルアミノフェノキシ基、4ージメチルアミノ

フェノキシ基、2-ジエチルアミノフェノキシ基、3-ジエチルアミノフェノキ シ基、4-ジエチルアミノフェノキシ基、2-ジ-(N-プロピル)アミノフェ ノキシ基、3-ジ-(N-プロピル)アミノフェノキシ基、4-ジ-(N-プロ ピル)アミノフェノキシ基、2-ジフェニルアミノフェノキシ基、3-ジフェニ ルアミノフェノキシ基、4-ジフェニルアミノフェノキシ基、2-アセチルアミ ノフェノキシ基、3-アセチルアミノフェノキシ基、4-アセチルアミノフェノ キシ基、2-プロピオニルアミノフェノキシ基、3-プロピオニルアミノフェノ キシ基、4-プロピオニルアミノフェノキシ基、2-ブチリルアミノフェノキシ 基、3-ブチリルアミノフェノキシ基、4-ブチリルアミノフェノキシ基、4-ペンタノイルアミノフェノキシ基、4ーヘキサノイルアミノフェノキシ基、3-10 (N-メチル-N-フェニルアミノ)フェノキシ基、2-(N-アセチル-N-メチルアミノ)フェノキシ基、2-カルバモイルアミノフェノキシ基、3-カル バモイルアミノフェノキシ基、4-カルバモイルアミノフェノキシ基、4-(N ーアセチル-N-フェニルアミノ)フェノキシ基、4-アセチルメチルフェノキ シ基、4-プロピオニルメチルフェノキシ基、4-n-ブチリルメチルフェノキ 15 シ基、4-(2-アセチルエチル)フェノキシ基、4-(3-アセチルプロピ ル)フェノキシ基、4-(4-アセチルブチル)フェノキシ基、4-(5-アセ チルペンチル)フェノキシ基、4-(6-アセチルヘキシル)フェノキシ基、2 ーヒドロキシフェノキシ基、3ーヒドロキシフェノキシ基、4ーヒドロキシフェ ノキシ基、2, 4-ジヒドロキシフェノキシ基、2, 4, 6-トリヒドロキシフ 20 ェノキシ基、2-ヒドロキシー3-クロロフェノキシ基、2-フルオロー3-ヒ ドロキシフェノキシ基、2-フルオロ-4-ヒドロキシフェノキシ基、4-メト キシカルボニルメチルフェノキシ基、4-エトキシカルボニルメチルフェノキシ 基、4-n-プロポキシカルボニルメチルフェノキシ基、4-(2-エトキシカ ルボニルエチル)フェノキシ基、4-(3-エトキシカルボニルプロピル)フェ 25 ノキシ基、4-(4-エトキシカルボニルブチル)フェノキシ基、4-(5-エ トキシカルボニルペンチル)フェノキシ基、4-(6-エトキシカルボニルヘキ シル)フェノキシ基、2ーベンジルフェノキシ基、3ーベンジルフェノキシ基、 4-ベンジルフェノキシ基、2-(2-フェニルエチル)フェノキシ基、3-

(2-フェニルエチル)フェノキシ基、4-(2-フェニルエチル)フェノキシ 基、2-(3-フェニルプロピル)フェノキシ基、3-(3-フェニルプロピ ル)フェノキシ基、4-(3-フェニルプロピル)フェノキシ基、2-(4-フ ェニルブチル)フェノキシ基、3-(4-フェニルブチル)フェノキシ基、4-(4-フェニルブチル)フェノキシ基、2-(5-フェニルペンチル)フェノキ 5 シ基、3-(5-フェニルペンチル)フェノキシ基、4-(5-フェニルペンチ ル)フェノキシ基、2-(6-フェニルヘキシル)フェノキシ基、3-(6-フ エニルヘキシル)フェノキシ基、4-(6-フェニルヘキシル)フェノキシ基、 2-アセチルフェノキシ基、3-アセチルフェノキシ基、4-アセチルフェノキ 10 シ基、4-n-プロピオニルフェノキシ基、4-n-ブチリルフェノキシ基、4 -n-ペンタノイルフェノキシ基、4-n-ヘキサノイルフェノキシ基、2-メ チルチオフェノキシ基、3-メチルチオフェノキシ基、4-メチルチオフェノキ シ基、4-エチルチオフェノキシ基、4-n-プロピルチオフェノキシ基、4-イソプロピルチオフェノキシ基、4-n-ブチルチオフェノキシ基、4tertーブチルチオフェノキシ基、4-nーペンチルチオフェノキシ基、4-15 n-ヘキシルチオフェノキシ基、2,4-ジメチルチオフェノキシ基、3,4, 5-ジメチルチオフェノキシ基、2-(1,2,4-トリアゾール-1-イル) フェノキシ基、3-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)フェノキシ基、4 - (1, 2, 4-トリアゾール-1-イル) フェノキシ基、2-(3-イソオキ サゾリル)フェノキシ基、3-(4-イソオキサゾリル)フェノキシ基、4-20 (5-イソオキサゾリル)フェノキシ基、2-(1-イミダゾリル)フェノキシ 基、3- (1-イミダゾリル) フェノキシ基、4- (1-イミダゾリル) フェノ キシ基、2-(2-ベンゾチアゾリル)フェノキシ基、3-(2-ベンゾチアゾ リル)フェノキシ基、4-(2-ベンゾチアゾリル)フェノキシ基、2-(2H ーベンゾトリアゾールー2ーイル)フェノキシ基、3-(2H-ベンゾトリアゾ 25 ールー2ーイル)フェノキシ基、4ー(2Hーベンゾトリアゾールー2ーイル) フェノキシ基、2-(1-ピロリル)フェノキシ基、3-(1-ピロリル)フェ ノキシ基、4-(1-ピロリル)フェノキシ基、2-(2-ベンゾオキサゾリ ル)フェノキシ基、3-(2-ベンゾオキサゾリル)フェノキシ基、4-(2-

ベンゾオキサゾリル)フェノキシ基、2-(1-ピペラジニル)フェノキシ基、 3- (1-ピペラジニル) フェノキシ基、4- (1-ピペラジニル) フェノキシ 基、4-(4-メトキシカルボニル-1-ピペラジニル)フェノキシ基、4-(4-エトキシカルボニル-1-ピペラジニル) フェノキシ基、4-(4-n-プロポキシカルボニル-1-ピペラジニル)フェノキシ基、4-(4-n-ブト キシカルボニルー1-ピペラジニル)フェノキシ基、4-(4-n-ペンチルオ キシカルボニルー1ーピペラジニル)フェノキシ基、4-(4-n-ヘキシルオ キシカルボニルー1-ピペラジニル)フェノキシ基、4-(4-ベンジルー1-ピペラジニル)フェノキシ基、4-(4-(2-フェネチル)-1-ピペラジニ ル)フェノキシ基、4-(4-(3-フェニルプロピル) -1-ピペラジニル) 10 フェノキシ基、4-(4-(4-フェニルブチル)-1-ピペラジニル)フェノ キシ基、4-(4-(5-フェニルペンチル)-1-ピペラジニル)フェノキシ 基、4-(4-(6-フェニルヘキシル)-1-ピペラジニル)フェノキシ基、 4- [4-(2-フルオロベンジル)-1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-[4-(3-フルオロベンジル) -1-ピペラジニル] フェノキシ基、<math>4-[415 - (4-フルオロベンジル) -1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-[4-(2-クロロベンジル) -1-ピペラジニル] フェノキシ基、<math>4-[4-(3-クロロベンジル) -1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-[4-(4-クロロ ベンジル) -1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-[4-(2,3-ジクロロ ベンジル) -1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-[4-(2,4-ジクロロ 20 ベンジル) -1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-[4-(3, 4-ジクロロ ベンジル) -1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-[4-(3,5-ジクロロ ベンジル) -1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-[4-(3,4,5-トリ クロロベンジル) -1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-[4-(2-トリフ ルオロメチルベンジル) -1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-[4-(3-25 トリフルオロメチルベンジル) -1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-[4-(4-トリフルオロメチルベンジル) -1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-[4-(4-メチルベンジル)-1-ピペラジニル]フェノキシ基、4-[4-(3, 4-ジメチルベンジル) -1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-[4-

(2, 4, 6-トリメチルベンジル) -1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-[4-(2-ペンタフルオロエチルベンジル)-1-ピペラジニル]フェノキシ 基、4-[4-(3-ペンタフルオロエチルベンジル)-1-ピペラジニル]フ ェノキシ基、4-[4-(4-ペンタフルオロエチルベンジル)-1-ピペラジ 5 ニル]フェノキシ基、4-[4-(2-トリフルオロメトキシベンジル)-1-ピペラジニル]フェノキシ基、4-[4-(3-トリフルオロメトキシベンジ ル) -1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-[4-(4-トリフルオロメトキ シベンジル) -1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-[4-(4-メトキシベ ンジル) -1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-[4-(3,4-ジメトキシ 10 ベンジル) -1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-[4-(2,4,6-トリ メトキシベンジル) -1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-[4-(2-ペン タフルオロエトキシベンジル) -1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-[4-(3-ペンタフルオロエトキシベンジル) -1-ピペラジニル] フェノキシ基、 4-「4-(4-ペンタフルオロエトキシベンジル)-1-ピペラジニル]フェ ノキシ基、4-{4-[2-(4-トリフルオロメトキシフェニル) エチル] -1-ピペラジニル}フェノキシ基、4-{4-[3-(4-トリフルオロメトキ シフェニル)プロピル]-1-ピペラジニル}フェノキシ基、4-{4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ブチル]-1-ピペラジニル}フェノキ シ基、4-{4-[5-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ペンチル]-1 - ピペラジニル}フェノキシ基、4- {4- [6- (4-トリフルオロメトキシ 20 フェニル) ヘキシル] -1-ピペラジニル} フェノキシ基、4-{4-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル) エチル] -1-ピペラジニル} フェノキシ 基、4-{4-[3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロピル]-1-ピ ペラジニル}フェノキシ基、4-{4-[4-(4-トリフルオロメチルフェニ ル) ブチル] -1-ピペラジニル} フェノキシ基、4- {4-[5-(4-トリ 25 フルオロメチルフェニル)ペンチル]-1-ピペラジニル}フェノキシ基、4-{4-[6-(4-トリフルオロメチルフェニル) ヘキシル] -1-ピペラジニ ル}フェノキシ基、2-ピペリジノフェノキシ基、3-ピペリジノフェノキシ基、 4-ピペリジノフェノキシ基、2-(4-アミノ-1-ピペリジル)フェノキシ

. 基、3-(4-アミノ-1-ピペリジル)フェノキシ基、4-(4-アミノ-1 - ピペリジル)フェノキシ基、4-(4-メチルアミノ-1-ピペリジル)フェ ノキシ基、4- (4-エチルアミノ-1-ピペリジル)フェノキシ基、4- (4 - n - プロピルアミノー1 - ピペリジル)フェノキシ基、4 - (4 - ジメチルア ミノ-1-ピペリジル)フェノキシ基、4-(4-ジエチルアミノ-1-ピペリ ジル)フェノキシ基、4-(4-ジ-n-プロピルアミノ-1-ピペリジル)フ ェノキシ基、4-(4-フェニルアミノ-1-ピペリジル)フェノキシ基、4-「4-(N-フェニル-N-メチルアミノ)-1-ピペリジル]フェノキシ基、 4- [4-(2-フルオロフェニルアミノ)-1-ピペリジル]フェノキシ基、 4-「4-(3-フルオロフェニルアミノ)-1-ピペリジル]フェノキシ基、 10 4- [4-(4-フルオロフェニルアミノ) -1-ピペリジル] フェノキシ基、 4- [4-(2-クロロフェニルアミノ)-1-ピペリジル]フェノキシ基、4 - [4-(3-クロロフェニルアミノ)-1-ピペリジル]フェノキシ基、4-「4-(4-クロロフェニルアミノ)-1-ピペリジル]フェノキシ基、4-[4-(2,3-ジクロロフェニルアミノ)-1-ピペリジル]フェノキシ基、 15 4-[4-(2, 4-ジクロロフェニルアミノ)-1-ピペリジル]フェノキシ 基、4-[4-(3,4-ジクロロフェニルアミノ)-1-ピペリジル]フェノ キシ基、4-[4-(3,5-ジクロロフェニルアミノ)-1-ピペリジル]フ ェノキシ基、4- [4-(2-トリフルオロメチルフェニルアミノ)-1-ピペ リジル]フェノキシ基、4-[4-(2-メチルフェニルアミノ)-1-ピペリ 20 ジル] フェノキシ基、4-[4-(2,3-ジメチルフェニルアミノ)-1-ピ ペリジル]フェノキシ基、4-[4-(2-トリフルオロメチルフェニルアミ ノ) -1-ピペリジル] フェノキシ基、4-[4-(2,4,6-トリメチルフ ェニルアミノ) -1-ピペリジル] フェノキシ基、4-[4-(4-トリフルオ ロメチルフェニルアミノ) -1-ピペリジル] フェノキシ基、4-[4-(2-25ペンタフルオロエチルフェニルアミノ)-1-ピペリジル]フェノキシ基、4-[4-(3-ペンタフルオロエチルフェニルアミノ)-1-ピペリジル]フェノ キシ基、4-[4-(4-ペンタフルオロエチルフェニルアミノ)-1-ピペリ ジル]フェノキシ基、4-[4-(2-トリフルオロメトキシフェニルアミノ)

-1-ピペリジル]フェノキシ基、4-[4-(2-メトキシフェニルアミノ) -1-ピペリジル]フェノキシ基、4-[4-(2,3-ジメトキシフェニルア ミノ) -1-ピペリジル] フェノキシ基、4-[4-(2,4,6-トリメトキ シフェニルアミノ) -1-ピペリジル] フェノキシ基、4- {4- [N-メチル -N-(2, 4, 6-)リメトキシフェニルアミノ)] -1-ピペリジル} フェ ノキシ基、4-{4-「N-メチル-N-(3,4,-ジメチルフェニルアミ ノ)]-1-ピペリジル} フェノキシ基、4-[4-(3-トリフルオロメトキ シフェニルアミノ) -1-ピペリジル] フェノキシ基、4-[4-(4-トリフ ルオロメトキシフェニルアミノ) -1-ピペリジル] フェノキシ基、4-[4-(2-ペンタフルオロエトキシフェニルアミノ)-1-ピペリジル]フェノキシ 10 基、4-[4-(3-ペンタフルオロエトキシフェニルアミノ)-1-ピペリジ ル] フェノキシ基、4-[4-(4-ペンタフルオロエトキシフェニルアミノ) -1-ピペリジル]フェノキシ基、2-カルバモイルフェノキシ基、3-カルバ モイルフェノキシ基、4-カルバモイルフェノキシ基等のフェノキシ基(フェニ ル環上には、ハロゲン原子:ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル 15 基;ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基;C1~4アルキレン ジオキシ基: C1~6アルコキシカルボニル基: シアノ基; C2~6アルケニル 基:ニトロ基:フェニル基:置換基としてフェニル基、C1~6アルキル基、カ ルバモイル基及びC1~6アルカノイル基からなる群より選ばれた基を1~2個 有することのあるアミノ基;C1~6アルカノイル置換C1~6アルキル基;水 20 酸基;C1~6アルコキシカルボニル置換C1~6アルキル基;フェニルC1~ 6アルキル基: C1~6アルカノイル基; C1~6アルキルチオ基; 1, 2, 4 トリアゾリル基;イソオキサゾリル基;イミダゾリル基;ベンゾチアゾリル 基:2H-ベンゾトリアゾリル基;ピロリル基;ベンゾオキサゾリル基;ピペラ ジニル基 [ピペラジン環上には、置換基としてC1~6アルコキシカルボニル基 25 及びフェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン 置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6ア ルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換して いてもよい。)からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい);ピ 5

ペリジル基 [ピペリジン環上には、置換基としてアミノ基(該アミノ基上には置換基として $C1\sim6$ アルキル基及びフェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基が $1\sim5$ 個、好ましくは $1\sim3$ 個置換していてもよい。)からなる群より選ばれた基が $1\sim3$ 個置換していてもよい。)を挙げることができる。

フェニル基(フェニル環上には、置換基としてフェノキシ基[フェニル環上に は、置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基 及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基 10 の少なくとも1種が置換していてもよい]、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未 置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基 からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、 例えば、フェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロ 15 ロフェニル基、2-ブロモフェニル基、3-ブロモフェニル基、4-ブロモフェ ニル基、2-ヨードフェニル基、3-ヨードフェニル基、4-ヨードフェニル基、 2, 3-ジフルオロフェニル基、3, 4-ジフルオロフェニル基、3, 5-ジフ ルオロフェニル基、2, 4-ジフルオロフェニル基、2, 6-ジフルオロフェニ ル基、2,3-ジクロロフェニル基、3,4-ジクロロフェニル基、3,5-ジ 20 クロロフェニル基、2、4ージクロロフェニル基、2、6ージクロロフェニル基、 2, 3, 4ートリフルオロフェニル基、3, 4, 5ートリフルオロフェニル基、 3, 4, 5-トリクロロフェニル基、2, 4, 6-トリフルオロフェニル基、2, 3, 4, 5, 6ーペンタフルオロフェニル基、2, 4, 6ートリクロロフェニル 基、2-フルオロー4-クロロフェニル基、2-フルオロー4-ブロモフェニル 25 基、3-フルオロー4-クロロフェニル基、2-メチルフェニル基、3-メチル ・フェニル基、4ーメチルフェニル基、2ーメチルー3ークロロフェニル基、3ー メチルー4ークロロフェニル基、2ークロロー4ーメチルフェニル基、2ーメチ ルー3-フルオロフェニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、3-トリフ

ルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、2-ペンタフル オロエチルフェニル基、3-ペンタフルオロエチルフェニル基、4-ペンタフル オロエチルフェニル基、2-イソプロピルフェニル基、3-イソプロピルフェニ ル基、4ーイソプロピルフェニル基、2-tertーブチルフェニル基、3tert-ブチルフェニル基、4-tert-ブチルフェニル基、2-sec-ブチルフェニル基、3-secーブチルフェニル基、4-secーブチルフェニ ル基、2-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプ ロピルフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-ペンチル フェニル基、4-ヘキシルフェニル基、2-フルオロ-4-ブロモフェニル基、 4-クロロ-3-フルオロフェニル基、2、3、4-トリクロロフェニル基、4 10 -n-ブチルフェニル基、2,4-ジメチルフェニル基、2,3-ジメチルフェ ニル基、2,4-ジメチルフェニル基、2,6-ジメチルフェニル基、3,5-ジメチルフェニル基、2,5-ジメチルフェニル基、2,4,6-トリメチルフ エニル基、3,5-ジトリフルオロメチルフェニル基、4-n-ブトキシフェニ ル基、2,4-ジメトキシフェニル基、2,3-ジメトキシフェニル基、2,6 15 -ジメトキシフェニル基、3,5-ジメトキシフェニル基、2,5-ジメトキシ フェニル基、3,5-ジトリフルオロメトキシフェニル基、2,4,6-トリメ トキシフェニル基、3-クロロー4-メトキシフェニル基、2-クロロー4-ト リフルオロメトキシフェニル基、3-メチル-4-フルオロフェニル基、4-ブ ロモー3ートリフルオロメチルフェニル基、2-メトキシフェニル基、3-メト 20 キシフェニル基、4-メトキシフェニル基、2-メトキシー3-クロロフェニル 基、2-フルオロー3-メトキシフェニル基、2-フルオロー4-メトキシフェ ニル基、2,6-ジメトキシフェニル基、2-トリフルオロメトキシフェニル基、 3-トリフルオロメトキシフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基、 2-ペンタフルオロエトキシフェニル基、3-ペンタフルオロエトキシフェニル 25 基、4-ペンタフルオロエトキシフェニル基、2-イソプロポキシフェニル基、 3-イソプロポキシフェニル基、4-イソプロポキシフェニル基、2-tert ーブトキシフェニル基、3-tert-ブトキシフェニル基、4-tert-ブ トキシフェニル基、2-sec-ブトキシフェニル基、3-sec-ブトキシフ

ェニル基、4-

sec-ブトキシフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、 3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロポ キシフェニル基、4ーペンチルオキシフェニル基、4ーヘキシルオキシフェニル 基、2-フェノキシフェニル基、3-フェノキシフェニル基、4-フェノキシフ ェニル基、2-(2-クロロフェノキシ)フェニル基、2-(3-クロロフェノ キシ)フェニル基、2-(4-クロロフェノキシ)フェニル基、3-(2-クロ ロフェノキシ)フェニル基、3-(3-クロロフェノキシ)フェニル基、3-(4-クロロフェノキシ) フェニル基、4-(2-クロロフェノキシ) フェニル 基、4-(3-クロロフェノキシ)フェニル基、4-(4-クロロフェノキシ) フェニル基、2-(2-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、、2-(2-メチルフェノキシ)フェニル基、2-(3-トリフルオロメチルフェノキ シ)フェニル基、2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、3-(2-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、3-(3-トリフルオロメ 15 チルフェノキシ)フェニル基、3-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)フェ ニル基、4-(2-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、4-(3-ト リフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、4-(4-トリフルオロメチルフェ ノキシ)フェニル基、2-(2-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、 2- (3-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、2- (4-トリフル オロメトキシフェノキシ)フェニル基、2-(4-メトキシフェノキシ)フェニ 20 ル基、2-(2,4-ジメチルフェノキシ)フェニル基、2-(2,4,6-ト リメチルフェノキシ)フェニル基、2-(3,4-ジメトキシフェノキシ)フェ ニル基、2-(3,4,5-トリメトキシフェノキシ)フェニル基、3-(2-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、3-(3-トリフルオロメトキ シフェノキシ)フェニル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェ 25 ニル基、4-(2-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、4-(3-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、4-(4-トリフルオロメトキ シフェノキシ)フェニル基等のフェニル基(フェニル環上には、置換基としてフ ェノキシ基 [フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は 未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基種が $1\sim5$ 個、好ましくは $1\sim3$ 個置換していてもよい]、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基が $1\sim5$ 個、好ましくは $1\sim3$ 個置換していてもよい)を挙げることができる。

C3~8シクロアルキル-C1~6アルコキシ基とは、炭素数3乃至8個の環 状アルキル基と炭素数1乃至6個のアルコキシ基で構成される基であって、例え ば、シクロプロピルメトキシ基、2ーシクロプロピルエトキシ基、3ーシクロプ ロピルプロポキシ基、4-シクロプロピルブトキシ基、5-シクロプロピルペン 10 チルオキシ基、6-シクロプロピルヘキシルオキシ基、シクロブチルメトキシ基、 2-シクロブチルエトキシ基、3-シクロブチルプロポキシ基、4-シクロブチ ルブトキシ基、5-シクロブチルペンチルオキシ基、6-シクロブチルヘキシル オキシ基、シクロペンチルメトキシ基、2-シクロペンチルエトキシ基、3-シ クロペンチルプロポキシ基、4ーシクロペンチルブトキシ基、5ーシクロペンチ 15 ルペンチルオキシ基、6-シクロペンチルヘキシルオキシ基、シクロヘキシルメ トキシ基、2-シクロヘキシルエトキシ基、3-シクロヘキシルプロポキシ基、 4-シクロヘキシルブトキシ基、5-シクロヘキシルペンチルオキシ基、6-シ クロヘキシルヘキシルオキシ基、シクロヘプチルメトキシ基、2-シクロヘプチ ルエトキシ基、3-シクロヘプチルプロポキシ基、4-シクロヘプチルブトキシ 基、5-シクロヘプチルペンチルオキシ基、6-シクロヘプチルヘキシルオキシ 20 基、シクロオクチルメトキシ基、2-シクロオクチルエトキシ基、3-シクロオ クチルプロポキシ基、4ーシクロオクチルブトキシ基、5ーシクロオクチルペン チルオキシ基、6-シクロオクチルヘキシルオキシ基等を挙げることができる。

フェニルカルバモイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又 は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)とは、フェニル環上にハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換されていてもよいアニリン、N-C

1~6アルキルアニリン又はN-フェニルC1~6アルキルアニリンとカルボニ ル基から構成される基であって、例えば、フェニルカルバモイル基、2-フルオ ロフェニルカルバモイル基、3-フルオロフェニルカルバモイル基、4-フルオ ロフェニルカルバモイル基、2ークロロフェニルカルバモイル基、3ークロロフ ェニルカルバモイル基、4-クロロフェニルカルバモイル基、2-ブロモフェニ 5 ルカルバモイル基、3-ブロモフェニルカルバモイル基、4-ブロモフェニルカ ルバモイル基、2-ヨードフェニルカルバモイル基、3-ヨードフェニルカルバ モイル基、4-ヨードフェニルカルバモイル基、2、3-ジフルオロフェニルカ ルバモイル基、3,4-ジフルオロフェニルカルバモイル基、3,5-ジフルオ ロフェニルカルバモイル基、2,4-ジフルオロフェニルカルバモイル基、2, 10 6-ジフルオロフェニルカルバモイル基、2、3-ジクロロフェニルカルバモイ ル基、3、4-ジクロロフェニルカルバモイル基、3、5-ジクロロフェニルカ ルバモイル基、2,4-ジクロロフェニルカルバモイル基、2,6-ジクロロフ ェニルカルバモイル基、3,4,5-トリフルオロフェニルカルバモイル基、2, 3, 4, 5, 6ーペンタフルオロフェニルカルバモイル基、3, 4, 5ートリク 15 ロロフェニルカルバモイル基、2,4,6-トリフルオロフェニルカルバモイル 基、2,4,6-トリクロロフェニルカルバモイル基、2-メチルフェニルカル バモイル基、3ーメチルフェニルカルバモイル基、4ーメチルフェニルカルバモ イル基、2-メチル-3-クロロフェニルカルバモイル基、3-メチル-4-ク ロロフェニルカルバモイル基、2-クロロー4-メチルフェニルカルバモイル基、 20 2-メチル-3-フルオロフェニルカルバモイル基、2-トリフルオロメチルフ ェニルカルバモイル基、3-トリフルオロメチルフェニルカルバモイル基、N-メチル-N-フェニルカルバモイル基、N-(2-フルオロフェニル)-N-メ チルカルバモイル基、N-(3-フルオロフェニル)-N-メチルカルバモイル 基、N-(4-フルオロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(2-ク 25 ロロフェニル) -N-メチルカルバモイル基、N-(3-クロロフェニル)-N -メチルカルバモイル基、N- (4-クロロフェニル) -N-メチルカルバモイ ル基、N- (4-ブロモフェニル) -N-メチルカルバモイル基、N- (2-ヨ ードフェニル) -N-メチルカルバモイル基、N-(3-ヨードフェニル)-N

-メチルカルバモイル基、N- (4-ヨードフェニル) -N-メチルカルバモイ ル基、N-(2,3-ジフルオロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(3, 4-ジフルオロフェニル) - N-メチルカルバモイル基、N-(3, 5-ジフルオロフェニル) - N - メチルカルバモイル基、N - (2, 4 - ジフルオロ フェニル) - N - メチルカルバモイル基、N - (2,6 - ジフルオロフェニル) -N-メチルカルバモイル基、N-(2,3-ジクロロフェニル)-N-メチル カルバモイル基、N-(3,4-ジクロロフェニル)-N-メチルカルバモイル 基、n-(3,5-ジクロロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(2, 4-ジクロロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(2,6-ジクロロ フェニル) - N-メチルカルバモイル基、N-(3, 4, 5-トリフルオロフェ 10 ニル) -N-メチルカルバモイル基、N-(3, 4, 5-トリクロロフェニル) -N-メチルカルバモイル基、N-(2,4,6-トリフルオロフェニル)-N -メチルカルバモイル基、N-(2, 4, 6-トリクロロフェニル)-N-メチ ルカルバモイル基、N-(2-メチルフェニル)-N-メチルカルバモイル基、 N- (3-メチルフェニル) -N-メチルカルバモイル基、N- (4-メチルフ 15 ェニル) -N-メチルカルバモイル基、N-(2-メチル-3-クロロフェニ ル) -N-メチルカルバモイル基、N-(3-メチル-4-クロロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(2-クロロ-4-メチルフェニル)-N-メ チルカルバモイル基、N-(2-メチル-3-フルオロフェニル)-N-メチル カルバモイル基、N- (2-トリフルオロメチルフェニル) -N-メチルカルバ 20 モイル基、N-(4-トリフルオロメチルフェニル)-N-メチルカルバモイル 基、N-ベンジル-N-フェニルカルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-フ · ルオロフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N- (3-フルオロフェニ ル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(4-フルオロフェニル) カルバモイ ル基、N-ベンジル-N-(2-クロロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジ 25ル-N-(3-クロロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(4-ク ロロフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-ブロモフェニル) カ ルバモイル基、N-ベンジル-N-(3-ブロモフェニル)カルバモイル基、N -ベンジル-N-(4-ブロモフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-

(2-ヨードフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3-ヨードフェ ニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(4-ヨードフェニル) カルバモイ ル基、N-ベンジル-N-(2,3-ジフルオロフェニル)カルバモイル基、N ーベンジル-N-(3,4-ジフルオロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジ ル-N-(3, 5-ジフルオロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2, 4-ジフルオロフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2, 6 -ジフルオロフェニル) カルバモイル基、n-ベンジル-N-(2,3-ジクロ ロフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3, 4-ジクロロフェニ ル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3,5-ジクロロフェニル) カルバ モイル基、N-ベンジル-N-(2,4-ジクロロフェニル)カルバモイル基、 10 N-ベンジル-N-(2,6-ジクロロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジ ルーN-(3, 4, 5-トリフルオロフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル -N-(3, 4, 5-トリクロロフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N - (2, 4, 6-トリフルオロフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2, 4, 6-トリクロロフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2 15 -メチルフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3-メチルフェニ ル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(4-メチルフェニル) カルバモイル 基、N-ベンジル-N-(2-メチル-3-クロロフェニル)カルバモイル基、 N-ベンジル-N-(3-メチル-4-クロロフェニル)カルバモイル基、n-ベンジル-N- (2-クロロー4-メチルフェニル) カルバモイル基、N-ベン 20 ジル-N-(2-メチル-3-フルオロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジ ル-N-(2-トリフルオロメチルフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3-トリフルオロメチルフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(4-トリフルオロメチルフェニル) カルバモイル基、2-ペンタフルオロエチ ルフェニルカルバモイル基、3ーペンタフルオロエチルフェニルカルバモイル基、 25 4-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイル基、2-イソプロピルフェニル カルバモイル基、3ーイソプロピルフェニルカルバモイル基、4ーイソプロピル フェニルカルバモイル基、2-tert-ブチルフェニルカルバモイル基、3tertーブチルフェニルカルバモイル基、4-tertーブチルフェニルカル

バモイル基、2-sec-ブチルフェニルカルバモイル基、3-sec-ブチル フェニルカルバモイル基、4-sec-ブチルフェニルカルバモイル基、2-n ーヘプタフルオロプロピルフェニルカルバモイル基、3-n-ヘプタフルオロプ ロピルフェニルカルバモイル基、 4-n-ヘプタフルオロプロピルフェニルカル - バモイル基、4-ペンチルフェニルカルバモイル基、4-ヘキシルフェニルカル バモイル基、2,4-ジメチルフェニルカルバモイル基、2,4,6-トリメチ ルフェニルカルバモイル基、3、4ージメトキシフェニルカルバモイル基、3、 4, 5-トリメトキシフェニルカルバモイル基、2-メトキシフェニルカルバモ イル基、3-メトキシフェニルカルバモイル基、4-メトキシフェニルカルバモ イル基、2-メトキシー3-クロロフェニルカルバモイル基、2-フルオロー3 10 ーメトキシフェニルカルバモイル基、2-フルオロー4-メトキシフェニルカル バモイル基、2,6-ジメトキシフェニルカルバモイル基、2,3,4-トリフ ルオロフェニルカルバモイル基、3,4,5-トリフルオロフェニルカルバモイ ル基、2-トリフルオロメトキシフェニルカルバモイル基、3-トリフルオロメ 15 トキシフェニルカルバモイル基、4ートリフルオロメトキシフェニルカルバモイ ル基、2ーペンタフルオロエトキシフェニルカルバモイル基、3ーペンタフルオ ロエトキシフェニルカルバモイル基、4-ペンタフルオロエトキシフェニルカル バモイル基、2-イソプロポキシフェニルカルバモイル基、3-イソプロポキシ フェニルカルバモイル基、4ーイソプロポキシフェニルカルバモイル基、2ー 20 tert-ブトキシフェニルカルバモイル基、3-tert-ブトキシフェニル カルバモイル基、4-tert-ブトキシフェニルカルバモイル基、2-sec ーブトキシフェニルカルバモイル基、3-sec-ブトキシフェニルカルバモイ ル基、 4 - s e c - ブトキシフェニルカルバモイル基、 2 - n - ヘプタフルオロ プロポキシフェニルカルバモイル基、3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニ ルカルバモイル基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニルカルバモイル基、 254-n-ペンチルオキシフェニルカルバモイル基、4-n-ヘキシルオキシフェ ニルカルバモイル基等を挙げることができる。

ナフチルオキシ基(ナフタレン環上には、少なくとも1個のC1~6アルキル 基が置換していてもよい。)としては、例えば、1-ナフチルオキシ基、2-ナ

15

フチルオキシ基、2-メチル-1-ナフチルオキシ基、3-メチル-1-ナフチルオキシ基、4-メチル-1-ナフチルオキシ基、5-メチル-1-ナフチルオキシ基、6-メチル-1-ナフチルオキシ基、7-メチル-1-ナフチルオキシ基、8-メチル-1-ナフチルオキシ基、1-メチル-2-ナフチルオキシ基、

5 5-メチルー2ーナフチルオキシ基、4ーエチルー1ーナフチルオキシ基、5-エチルー1ーナフチルオキシ基、6ーエチルー1ーナフチルオキシ基、1ーエチ ルー2ーナフチルオキシ基、5ーエチルー2ーナフチルオキシ基、5ーnープロ ピルー1ーナフチルオキシ基、6ーnープロピルー1ーナフチルオキシ基、1ー nープロピルー2ーナフチルオキシ基、5ーnープロピルー2ーナフチルオキシ

基、5-n-ブチルー1-ナフチルオキシ基、6-n-ブチルー1-ナフチルオキシ基、1-n-ブチルー2-ナフチルオキシ基、5-n-ブチルー2-ナフチルオキシ基、6-n-ペンチルー1-ナフチルオキシ基、6-n-ペンチルー1-ナフチルオキシ基、5-n-ペンチルー2-ナフチルオキシ基、5-n-ペンチルー2-ナフチルオキシ基、5-n-ペンチルー2-ナフチルオキシ基、5-n-ペンチルー2-ナフチルオキシ基、5-n-ペンチルー2-ナフチルオキシ基、5-n-ペンチルー2-ナフチルオキシ基、3-n-ペンチルー3-ナフチルオキシ基、3-n-ペンチルー3-ナフチルオキシ基、3-

 $n- \wedge + \nu - 1 - t$ フチルオキシ基、 $1- n- \wedge + \nu - 2 - t$ フチルオキシ 基、 $5- n- \wedge + \nu - 2 - t$ フチルオキシ基、2 、 $4- \nu + \nu - 1 - t$ フチルオキシ基、4 、6 、7- h リメチル- 2- t フチルオキシ基等のナフチルオキシ基 (ナフタレン環上には、置換基として $C1 \sim 6$ アルキル基が $1 \sim 3$ 個置換していてもよい。)を挙げることができる。

20 2,3-ジヒドロベンゾフリルオキシ基(2,3-ジヒドロベンゾフラン環上には、C1~6アルキル基及びオキソ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。)としては、例えば、2,3-ジヒドロベンゾフラン-3-イルオキシ基、2,3-ジヒドロベンゾフランー4-イルオキシ基、2,3-ジヒドロベンゾフランー5-イルオキシ基、2,3-ジヒドロベンゾフラン-5-イルオキシ基、2,3-ジヒドロベンゾフラン-7-イルオキシ基、2ーオキソー2,3-ジヒドロベンゾフラン-3-イルオキシ基、2ーオキソー2,3-ジヒドロベンゾフラン-4-イルオキシ基、2-オキソー2,3-ジヒドロベンゾフラン-5-イルオキシ基、2-オキソー2,3-ジヒドロベンゾフラン-5-イルオキシ基、2-オキソー2,3-ジヒドロベンゾフラン-6-イルオキシ基、2-オキソー2,3-ジヒドロベンゾフラン-7-イルオ

キシ基、3-オキソー2、3-ジヒドロベンゾフラン-2-イルオキシ基、3-オキソー2,3-ジヒドロベンゾフラン-4-イルオキシ基、3-オキソー2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イルオキシ基、3-オキソー2、3-ジヒドロ ベンゾフランー6-イルオキシ基、3-オキソー2,3-ジヒドロベンゾフラン 5 - 7-イルオキシ基、2-メチル-2,3-ジヒドロベンゾフラン-3-イルオ キシ基、2-メチルー2,3-ジヒドロベンゾフランー4-イルオキシ基、2-メチルー2,3-ジヒドロベンゾフラン-5-イルオキシ基、2-メチルー2, 3-ジヒドロベンゾフランー6-イルオキシ基、2-メチルー2,3-ジヒドロ ベンゾフランー7ーイルオキシ基、2ーエチルー2,3ージヒドロベンゾフラン 10 -3-イルオキシ基、2-エチルー2、3-ジヒドロベンゾフランー4-イルオ キシ基、2-エチル-2、3-ジヒドロベンゾフラン-5-イルオキシ基、2-エチルー2.3ージヒドロベンゾフランー6ーイルオキシ基、2ーエチルー2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イルオキシ基、4-メチル-2,3-ジヒドロ ベンゾフランー3-イルオキシ基、5-メチル-2,3-ジヒドロベンゾフラン 15 - 4-イルオキシ基、4-メチル-2、3-ジヒドロベンゾフラン-5-イルオ キシ基、4-メチル-2、3-ジヒドロベンゾフラン-6-イルオキシ基、4-メチルー2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イルオキシ基、5-メチルー2, 3-ジヒドロベンゾフランー3-イルオキシ基、4-メチルー2,3-ジヒドロ ベンゾフランー6-イルオキシ基、4-メチルー2,3-ジヒドロベンゾフラン - 7 - イルオキシ基、6 - メチルー2, 3 - ジヒドロベンゾフラン - 3 - イルオ 20 キシ基、6-メチルー2,3-ジヒドロベンゾフランー4-イルオキシ基、6-メチルー2,3-ジヒドロベンゾフラン-5-イルオキシ基、6-メチルー2, 3-ジヒドロベンゾフランー7-イルオキシ基、7-メチルー2, 3-ジヒドロ ベンゾフラシー3-イルオキシ基、7-メチルー2,3-ジヒドロベンゾフラン - 4 - イルオキシ基、7 - メチルー2, 3 - ジヒドロベンゾフランー5 - イルオ 25 キシ基、7-メチルー2、3-ジヒドロベンブフランー6-イルオキシ基、2nープロピルー2.3ージヒドロベンゾフラン-5-イルオキシ基、2-nープ ロピルー2、3-ジヒドロベンゾフランー6-イルオキシ基、2-n-ブチルー 2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イルオキシ基、2-n-ブチル-2, 3ジヒドロベンゾフランー6ーイルオキシ基、2-nーペンチルー2、3ージヒドロベンゾフランー5ーイルオキシ基、2-nーペンチルー2、3ージヒドロベンゾフランー6ーイルオキシ基、2-nーヘキシルー2、3ージヒドロベンゾフランー5ーイルオキシ基、2-nーヘキシルー2、3ージヒドロベンゾフランー6 1 ーイルオキシ基、2・2・ジメチルー2、3ージヒドロベンゾフランー5ーイルオキシ基、2・2・4ートリメチルー2、3ージヒドロベンゾフランー5ーイルオキシ基、3ーオキソー4ーメチルー2、3ージヒドロベンゾフランー5ーイルオキシ基、2・2ージメチルー3ーオキソー2、3ージヒドロベンゾフランー5ーイルオキシ基等の2、3ージヒドロベンゾフリルオキシ基(2、3ージヒドロベンゾフラン第上には、C1~6アルキル基及びオキソ基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい)が挙げられる。

ベンゾチアゾリルオキシ基 (ベンゾチアゾール環上には、少なくとも1個のC 1~6アルキル基が置換していてもよい)としては、例えば、2-ベンゾチアゾ リルオキシ基、4ーベンゾチアゾリルオキシ基、5ーベンゾチアゾリルオキシ基、 6-ベンゾチアゾリルオキシ基、7-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-メチルー 15 5-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-メチル-5-ベンゾチアゾリルオキシ基、 6-メチル-5-ベンゾチアゾリルオキシ基、7-メチル-5-ベンゾチアゾリ ルオキシ基、4-エチルー2-ベンゾチアゾリルオキシ基、5-エチルー2-ベ ンゾチアゾリルオキシ基、6-エチル-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、7-エ チルー6-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-n-プロピルー7-ベンゾチアゾリ 20 ルオキシ基、5-n-プロピル-2-ベンゾチアゾリルオキシ基、6-n-プロ ピルー2ーベンゾチアゾリルオキシ基、7-n-プロピルー5-ベンゾチアゾリ ルオキシ基、4-n-ブチル-5-ベンゾチアゾリルオキシ基、5-n-ブチル -2-ベンゾチアゾリルオキシ基、6-n-ブチル-2-ベンゾチアゾリルオキ シ基、7-n-ブチルー4-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-n-ペンチルー6 25 -ベンゾチアゾリルオキシ基、5-n-ペンチル-7-ベンゾチアゾリルオキシ 基、6-n-ペンチルー2-ベンゾチアゾリルオキシ基、7-n-ペンチルー2 -ベンゾチアゾリルオキシ基、4-n-ヘキシル-2-ベンゾチアゾリルオキシ 基、5-n-ヘキシル-2-ベンゾチアゾリルオキシ基、6-n-ヘキシル-2 ーベンゾチアゾリルオキシ基、7-n-ヘキシルー2-ベンゾチアゾリルオキシ基、2, 4-ジメチルー5-ベンゾチアゾリルオキシ基等のベンゾチアゾリルオキシ基(ベンゾチアゾリルオキシ基(ベンゾチアゾリルオキシ基(ベンゾチアゾール環上には、C1~6アルキル基が1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

1, 2, 3, 4ーテトラヒドロナフチルオキシ基(1, 2, 3, 4ーテトラヒドロナフタレン環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい)としては、例えば、1, 2, 3, 4ーテトラヒドロー1ーナフチルオキシ基、1, 2, 3, 4ーテトラヒドロー2ーナフチルオキシ基、1, 2, 3, 4ーテトラヒドロー6ーナフチルオキシ基、1, 2, 3, 4ーテトラヒドロー5ーナフチルオキシ基、1, 2, 3, 4ーテトラヒドロー1ーオキソー5ーナフチルオキシ基、1, 2, 3, 4ーテトラヒドロー2ーオキソー3ーナフチルオキシ基、1, 2, 3, 4ーテトラヒドロー1ーオキソー6ーナフチルオキシ基、1, 2, 3, 4ーテトラヒドロー3ーオキソー6ーナフチルオキシ基、1, 2, 3, 4ーテトラヒドロー2ーオキソー6ーナフチルオキシ基、1, 2, 3, 4ーテトラヒドロー2ーオキソー7ーナフチルオキシ基、1, 2, 3, 4ーテトラヒドロー2ーオキソー7ーナフチルオキシ基等を挙げることができる。

1, 3 - ベンゾオキサチオラニルオキシ基(1, 3 - ベンゾオキサチオラン環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい)としては、例えば、

20 1、3-ベンゾオキサチオラン-4-イルオキシ基、1、3-ベンゾオキサチオラン-5-イルオキシ基、1、3-ベンゾオキサチオラン-6-イルオキシ基、1、3-ベンゾオキサチオラン-7-イルオキシ基、2-オキソ-1、3-ベンゾオキサチオラン-5-イルオキシ基、2-オキソ-1、3-ベンゾオキサチオラン-6-イルオキシ基、2-オキソ-1、3-ベンゾオキサチオラン-7-インスを表表を挙げることができる。

イソキノリルオキシ基としては、例えば、イソキノリン-1-イルオキシ基、 イソキノリン-3-イルオキシ基、イソキノリン-4-イルオキシ基、イソキノ リン-5-イルオキシ基、イソキノリン-6-イルオキシ基、イソキノリン-7 -イルオキシ基、イソキノリン-8-イルオキシ基等が挙げられる。 ピリジルオキシ基は、2-ピリジルオキシ基、3-ピリジルオキシ基、及び4-ピリジルオキシ基を含む。

キノリルオキシ基(キノリン環上には、少なくとも1個のC1~6アルキル基 が置換していてもよい)としては、例えば、2-キノリルオキシ基、3-キノリ ルオキシ基、4-キノリルオキシ基、5-キノリルオキシ基、6-キノリルオキ シ基、7-キノリルオキシ基、8-キノリルオキシ基、3-メチルー2-キノリ ルオキシ基、4-メチル-2-キノリルオキシ基、5-メチル-2-キノリルオ キシ基、6-メチル-2-キノリルオキシ基、7-メチル-2-キノリルオキシ 基、2-メチル-3-キノリルオキシ基、4-メチル-3-キノリルオキシ基、 5-メチル-3-キノリルオキシ基、6-メチル-3-キノリルオキシ基、7-10 メチルー3-キノリルオキシ基、8-メチルー3-キノリルオキシ基、2-メチ ルー4ーキノリルオキシ基、3-メチルー4-キノリルオキシ基、5-メチルー 4-キノリルオキシ基、6-メチルー4-キノリルオキシ基、7-メチルー4-キノリルオキシ基、8-メチル-4-キノリルオキシ基、2-メチル-5-キノ リルオキシ基、4-メチル-5-キノリルオキシ基、3-メチル-5-キノリル 15 オキシ基、6-メチル-5-キノリルオキシ基、7-メチル-5-キノリルオキ ・シ基、8-メチル-5-キノリルオキシ基、2-メチル-6-キノリルオキシ基、 4-メチル-6-キノリルオキシ基、5-メチル-6-キノリルオキシ基、3-メチルー6-キノリルオキシ基、7-メチルー6-キノリルオキシ基、8-メチ 20 ルー6ーキノリルオキシ基、2ーメチルー7ーキノリルオキシ基、4ーメチルー 7-キノリルオキシ基、5-メチル-7-キノリルオキシ基、6-メチル-7-キノリルオキシ基、3-メチル-7-キノリルオキシ基、8-メチル-7-キノ リルオキシ基、2-メチル-8-キノリルオキシ基、4-メチル-8-キノリル オキシ基、5-メチル-8-キノリルオキシ基、6-メチル-8-キノリルオキ シ基、7-メチル-8-キノリルオキシ基、3-メチル-8-キノリルオキシ基、 25 2. 5-ジメチル-8-キノリルオキシ基、6, 7-ジメチル-4-キノリルオ キシ基、4,6,7-トリメチルー5-キノリルオキシ基及びこれらの化合物群 のメチル基をエチル基、n-プロピル基、n-ブチル基、n-ペンチル基又はn ーヘキシル基に置換した化合物群等のキノリルオキシ基(キノリン環上には、置

換基として $C1\sim6$ アルキル基が $1\sim3$ 個置換していてもよい。)を挙げることができる。

ジベンゾフリルオキシ基は、1 - ジベンゾフリルオキシ基、2 - ジベンゾフリ ルオキシ基、3 - ジベンゾフリルオキシ基、4 - ジベンゾフリルオキシ基、5 -5 ジベンゾフリルオキシ基、6 - ジベンゾフリルオキシ基、7 - ジベンゾフリルオ キシ基、8 - ジベンゾフリルオキシ基及び9 - ジベンゾフリルオキシ基を含む。

2H-クロメニルオキシ基(2H-クロメン環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい)としては、例えば、4-(2H)クロメニルオキシ基、5-(2H)クロメニルオキシ基、6-(2H)クロメニルオキシ基、710 (2H)クロメニルオキシ基、8-(2H)クロメニルオキシ基、2-オキソー4-(2H)クロメニルオキシ基、2-オキソー5-(2H)クロメニルオキシ基、2-オキソー5-(2H)クロメニルオキシ基、2-オキソー7-(2H)クロメニルオキシ基、2-オキソー8-(2H)クロメニルオキシ基等を挙げることができる。

15 ベンゾイソオキサゾリルオキシ基としては、例えば、3ーベンゾイソオキサゾ リルオキシ基、4ーベンゾイソオキサゾリルオキシ基、5ーベンゾイソオキサゾ リルオキシ基、6ーベンゾイソオキサゾリルオキシ基、7ーベンゾイソオキサゾ リルオキシ基等を挙げることができる。

キノキサリルオキシ基としては、例えば、2-キノキサリルオキシ基、5-キ 20 ノキサリルオキシ基、6-キノキサリルオキシ基等を挙げることができる。

2,3-ジヒドロ-1H-インデニルオキシ基(2,3-ジヒドロ-1H-インデン環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい)としては、例えば、2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イルオキシ基、2,3-ジヒドロ-1H-インデン
25 -3-イルオキシ基、2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イルオキシ基、2,3-ジヒドロ-1H-インデン-5-イルオキシ基、2,3-ジヒドロ-1
H-インデン-6-イルオキシ基、2,3-ジヒドロ-1H-インデン-7-イルオキシ基、2,3-ジヒドロ-1-オキソー1H-インデン-2-イルオキシ基、2,3-ジヒドロ-1-オキソー1H-インデン-2-イルオキシ基、2,3-ジヒドロ-1-オキソー1H-インデン-3-イルオキシ基、2,

3 - ジヒドロー1 - オキソー1 H - インデンー4 - イルオキシ基、2,3 - ジヒドロー1 - オキソー1 H - インデンー5 - イルオキシ基、2,3 - ジヒドロー1 - オキソー1 H - インデンー6 - イルオキシ基、2,3 - ジヒドロー1 - オキソー1 H - インデンー7 - イルオキシ基等を挙げることができる。

5 ベンゾフラザニルオキシ基としては、例えば、4ーベンゾフラザニルオキシ基、 5ーベンゾフラザニルオキシ基等を挙げることができる。

フェニルC2~6アルケニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン 置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6ア ルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)

- 10 とは、無置換又はハロゲン原子、ハロゲンC1~6アルキル基及びハロゲン置換 もしくは未置換のC1~6アルコキシ基から選ばれた基が1~5個、好ましくは 1~3個置換されたフェニル基と炭素数2から6で少なくとも二重結合を1個有 するアルケニル基から構成される基である。フェニルC2~6アルケニル基は、 トランス体及びシス体の両者を包含する。このようなフェニルC2~6アルケニ
- ル基としては、例えば、前記したフェニルC2~6アルケニル基に加えて、3-(2-フルオロフェニル) -2-プロペニル基、3-(3-フルオロフェニル) -2-プロペニル基、3-(2-プロペニル基、3-(2,3-ジフルオロフェニル) -2-プロペニル基、3-(2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニル) -2-プロペニル基、3-(2,4-ジフルオロクェニル) -2-プロペニル基、3-(2,4-ジフルオロクェニル) -2-プロペニル
- 20 フェニル)-2-プロペニル基、3-(3, 4-ジフルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(3, 5-ジフルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2-クロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(3-クロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 3-ジクロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 4-ジクロロフェニル)-2-プロペニルスニール)-2-プロペニルスニール
- 25 ル) -2-プロペニル基、3-(3,4-ジクロロフェニル) -2-プロペニル 基、3-(3,5-ジクロロフェニル) -2-プロペニル基、3-(2-ブロモ フェニル) -2-プロペニル基、3-(3-ブロモフェニル) -2-プロペニル 基、3-(4-ブロモフェニル) -2-プロペニル基、3-(2-メチルフェニ ル) -2-プロペニル基、3-(3-メチルフェニル) -2-プロペニル基、3

- (4-メチルフェニル) - 2-プロペニル基、3-(2-トリフルオロメチル フェニル) -2-プロペニル基、3-(2-フルオロ-4-ブロモフェニル) -2-プロペニル基、3-(4-クロロ-3-フルオロフェニル)-2-プロペニ ル基、3-(2, 3, 4-)リクロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 3)4,6ートリクロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-イソプロピルフ ェニル) -2-プロペニル基、3-(4-n-ブチルフェニル) -2-プロペニ ル基、3-(2, 4-ジメチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 3-ジメチルフェニル) -2-プロペニル基、3-(2,6-ジメチルフェニル) -2-プロペニル基、3-(3,5-ジメチルフェニル)-2-プロペニル基、3 - (2,5-ジメチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(2,4,6-トリ 10 メチルフェニル) -2-プロペニル基、3-(3,5-ジトリフルオロメチルフ ェニル) -2 - プロペニル基、3 - (4 - n - ブトキシフェニル) -2 - プロペ ニル基、3-(2,4-ジメトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 3-ジメトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(2,6-ジメトキシフェ ニル) -2-プロペニル基、3-(3,5-ジメトキシフェニル) -2-プロペ ニル基、3-(2,5-i)メトキシフェニル)-2-iロペニル基、3-(3,5)5-ジトリフルオロメトキシフェニル) -2-プロペニル基、3-(3-クロロ -4-メトキシフェニル) -2-プロペニル基、3-(2-クロロ-4-トリフ ルオロメトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(3-メチル-4-フルオ ロフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-ブロモー3-トリフルオロメチル 20 フェニル) -2-プロペニル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル) -2 ープロペニル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニル基、 3-(2-トリフルオロメトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(3-ト リフルオロメトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-トリフルオロメ トキシフェニル) -2-プロペニル基、3-(2-メトキシフェニル) -2-プ 25 ロペニル基、3-(3-メトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-メ トキシフェニル) -2-プロペニル基、3-(3,4-ジメトキシフェニル) -2-プロペニル基、4-(4-クロロフェニル)-2-ブテニル基、4-(4-クロロフェニル) -3-ブテニル基、5-(4-クロロフェニル) -2-ペンテ

5

ニル基、 $5-(4-\rho pp pp relation 2) -4-ペンテニル基、<math>5-(4-\rho pp pp relation 2) -3-ペンテニル基、<math>6-(4-\rho pp pp relation 2) -5-ヘキセニル基、<math>6-(4-\rho pp pp relation 2) -4-ヘキセニル基、<math>6-(4-\rho pp pp relation 2) -3-ヘキセニル基、<math>6-(4-\rho pp pp relation 2) -3-ヘキセニル基等を挙げることができる。$

C1~6アルキル基(アルキル基には、モルホリノ基、ベンゾイル基、置換基 としてC1~6アルキル基を有することのあるカルバモイル基又はシアノ基が置 換していてもよい)としては、例えば、メチル基、エチル基、nープロピル基、 n-ブチル基、n-ペンチル基、n-ヘキシル基、モルホリノメチル基、2-モ ルホリノエチル基、3-モルホリノプロピル基、4-モルホリノブチル基、5-10 モルホリノペンチル基、6-モルホリノヘキシル基、ベンゾイルメチル基、2-ベンゾイルエチル基、1-ベンゾイルエチル基、3-ベンゾイルプロピル基、4 ーベンゾイルブチル基、5ーベンゾイルペンチル基、6ーベンゾイルヘキシル基、 カルバモイルメチル基、2-カルバモイルエチル基、1-カルバモイルエチル基、 3-カルバモイルプロピル基、4-カルバモイルブチル基、5-カルバモイルペ 15 ンチル基、6-カルバモイルヘキシル基、2-メチル-3-カルバモイルプロピ ル基、1,1-ジメチル-2-カルバモイルエチル基、メチルカルバモイルメチ ル基、2-メチルカルバモイルエチル基、3-メチルカルバモイルプロピル基、 4-メチルカルバモイルブチル基、5-メチルカルバモイルペンチル基、6-メ チルカルバモイルヘキシル基、ジメチルカルバモイルメチル基、2-ジメチルカ 20 ルバモイルエチル基、3-ジメチルカルバモイルプロピル基、4-ジメチルカル バモイルブチル基、5-ジメチルカルバモイルペンチル基、6-ジメチルカルバ モイルヘキシル基、ジエチルカルバモイルメチル基、2-ジエチルカルバモイル エチル基、3-ジエチルカルバモイルプロピル基、4-ジエチルカルバモイルブ チル基、5-ジエチルカルバモイルペンチル基、6-ジエチルカルバモイルヘキ 25 シル基、n-プロピルカルバモイルメチル基、2-n-プロピルカルバモイルエ チル基、3-n-プロピルカルバモイルプロピル基、4-n-プロピルカルバモ イルブチル基、5-n-プロピルカルバモイルペンチル基、6-n-プロピルカ ルバモイルヘキシル基、n-ブチルカルバモイルメチル基、2-n-ブチルカル

バモイルエチル基、3-n-ブチルカルバモイルプロピル基、4-n-ブチルカルバモイルブチル基、5-n-ブチルカルバモイルペンチル基、6-n-ブチルカルバモイルへキシル基、n-ヘキシルカルバモイルメチル基、2-n-ヘキシルカルバモイルエチル基、3-n-ヘキシルカルバモイルプロピル基、4-n-5・ヘキシルカルバモイルブチル基、5-n-ヘキシルカルバモイルペンチル基、6-n-ヘキシルカルバモイルペンチル基、2-シアノエチル基、1-シアノエチル基、3-シアノプロピル基、4-シアノブチル基、5-シアノペンチル基、6-シアノヘキシル基等を挙げることができる。

フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、 フェニル基、ニトロ基、C1~6アルキルチオ基、C1~6アルキルスルホニル 10 基、フェニルC1~6アルコキシ基、C2~6アルカノイルオキシ基、ハロゲン 置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1 ~6アルコキシ基及び1、2、3-チアジアゾリル基からなる群より選ばれた基 の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、ベンジル基、1-フェネチル基、2-フェネチル基、3-フェニルプロピル基、2-フェニルプロ 15 ピル基、4-フェニルブチル基、5-フェニルペンチル基、4-フェニルペンチ ル基、6-フェニルヘキシル基、4-ビフェニリルメチル基、2-(4-ビフェ ニリル) エチル基、3-(4-ビフェニリル) プロピル基、2-(4-ビフェニ リル)プロピル基、4ー(4ービフェニリル)ブチル基、5ー(4ービフェニリ ル) ペンチル基、4-(4-ビフェニリル) ペンチル基、6-(4-ビフェニリ 20 ル) ヘキシル基、2-フルオロベンジル基、3-フルオロベンジル基、4-フル オロベンジル基、2ークロロベンジル基、3ークロロベンジル基、4ークロロベ ンジル基、2-ブロモベンジル基、3-ブロモベンジル基、4-ブロモベンジル 基、2-ヨードベンジル基、3-ヨードベンジル基、4-ヨードベンジル基、2, 3-ジフルオロベンジル基、3,4-ジフルオロベンジル基、3,5-ジフルオ 25 ロベンジル基、2,4-ジフルオロベンジル基、2,6-ジフルオロベンジル基、 2, 4, 6-トリフルオロベンジル基、3, 4, 5-トリフルオロベンジル基、 2, 3-ジクロロベンジル基、3, 4-ジクロロベンジル基、3, 5-ジクロロ ベンジル基、2,4-ジクロロベンジル基、2,6-ジクロロベンジル基、2,

4,6-トリクロロベンジル基、3,4,5-トリクロロベンジル基、2-ジフ ルオロメチルベンジル基、3-ジフルオロメチルベンジル基、4-ジフルオロメ チルベンジル基、4-クロロー3-ジフルオロメチルベンジル基、3-クロロー 4-ジフルオロメチルベンジル基、3-ブロモ-4-ジフルオロメチルベンジル - 基、3、5-ジフルオロー4-ジフルオロメチルベンジル基、2-フルオロー4 ーブロモベンジル基、4ークロロー3ーフルオロベンジル基、2,3,4ートリ クロロベンジル基、4-イソプロピルベンジル基、4-n-ブチルベンジル基、 4-メチルベンジル基、2-メチルベンジル基、3-メチルベンジル基、2,4 -ジメチルベンジル基、2、3-ジメチルベンジル基、2、6-ジメチルベンジ ル基、3、5-ジメチルベンジル基、2、5-ジメチルベンジル基、2、4、6 10 ートリメチルベンジル基、3、5ージトリフルオロメチルベンジル基、4ーイソ プロポキシベンジル基、4-n-ブトキシベンジル基、4-メトキシベンジル基、 2-メトキシベンジル基、3-メトキシベンジル基、2,4-ジメトキシベンジ ル基、2,3-ジメトキシベンジル基、2,6-ジメトキシベンジル基、3,5 -ジメトキシベンジル基、2,5-ジメトキシベンジル基、2,4,6-トリメ 15 トキシベンジル基、3,5-ジトリフルオロメトキシベンジル基、2,3,4, 5,6-ペンタフルオロベンジル基、2-イソプロポキシベンジル基、3-クロ ロー4ーメトキシベンジル基、2ークロロー4ートリフルオロメトキシベンジル 基、3-メチル-4-フルオロベンジル基、4-ブロモー3-トリフルオロメチ ルベンジル基、2-トリフルオロメチルベンジル基、3-トリフルオロメチルベ 20 ンジル基、4ートリフルオロメチルベンジル基、4ーフルオロー3ートリフルオ ロメチルベンジル基、3ーフルオロー4ートリフルオロメチルベンジル基、4ー クロロー3ーペンタフルオロエチルベンジル基、3ークロロー4ーペンタフルオ ロエチルベンジル基、2-ペンタフルオロエチルベンジル基、3-ペンタフルオ ロエチルベンジル基、4ーペンタフルオロエチルベンジル基、2ートリフルオロ 25 メトキシベンジル基、3-トリフルオロメトキシベンジル基、4-トリフルオロ メトキシベンジル基、4-フルオロ-3-トリフルオロメトキシベンジル基、3 -フルオロ-4-トリフルオロメトキシベンジル基、2-ペンタフルオロエトキ シベンジル基、3-ペンタフルオロエトキシベンジル基、4-ペンタフルオロエ

トキシベンジル基、3-クロロ-4-トリフルオロメトキシベンジル基、3-ク ロロー4ーペンタフルオロエトキシベンジル基、2-(2-トリフルオロメチル フェニル)エチル基、2-(3-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル) エチル基、2-(2-トリフルオロメトキ シフェニル)エチル基、2-(3-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、 2- (4-トリフルオロメトキシフェニル) エチル基、2- (2-ペンタフルオ ロエトキシフェニル) エチル基、2-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル) エチル基、2- (4-ペンタフルオロエトキシフェニル) エチル基、3- (2-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(3-トリフルオロメチルフェ ニル)プロピル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-10 (2-トリフルオロメトキシフェニル) プロピル基、3-(3-トリフルオロメ トキシフェニル)プロピル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)プロ ピル基、3-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)プロピル基、3-(4-ペンタフルオロエトキシフェニル)プロピル基、4-(3-ペンタフルオロエト キシフェニル)ブチル基、5-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチル基、 15 4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチル基、4-(4-トリフルオロ メトキシフェニル)ペンチル基、6-(3-トリフルオロメチルフェニル)へキ シル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル) ヘキシル基、6-(4-トリ フルオロメトキシフェニル) ヘキシル基、2-メチルチオベンジル基、3-メチ ルチオベンジル基、4-メチルチオベンジル基、2,3-ジメチルチオベンジル 20 基、2、4、6-トリメチルチオベンジル基、2-(2-メチルチオフェニル) エチル基、2- (3-メチルチオフェニル) エチル基、2- (4-メチルチオフ エニル) エチル基、3-(4-メチルチオフェニル) プロピル基、4-(4-メ チルチオフェニル)ブチル基、5-(4-メチルチオフェニル)ペンチル基、6 - (4-メチルチオフェニル) ヘキシル基、2-ベンジルオキシベンジル基、3 25 ーベンジルオキシベンジル基、4ーベンジルオキシベンジル基、2-(2-ベン ジルオキシフェニル) エチル基、2- (3-ベンジルオキシフェニル) エチル基、 2- (4-ベンジルオキシフェニル) エチル基、3- (4-ベンジルオキシフェ ニル)プロピル基、4-(4-ベンジルオキシフェニル)ブチル基、5-(4-

ベンジルオキシフェニル)ペンチル基、6-(4-ベンジルオキシフェニル)へ キシル基、2-(2-フェニルエトキシ)ベンジル基、3-(2-フェニルエト キシ) ベンジル基、4-(2-フェニルエトキシ) ベンジル基、2-(2-(2--フェニルエトキシ)フェニル)エチル基、2-(3-(2-フェニルエトキ 5 シ)フェニル)エチル基、2-(4-(2-フェニルエトキシ)フェニル)エチ ル基、3-(4-(2-フェニルエトキシ)フェニル)プロピル基、4-(4-(2-フェニルエトキシ) フェニル) ブチル基、5-(4-(2-フェニルエト キシ)フェニル)ペンチル基、6-(4-(2-フェニルエトキシ)フェニル) ヘキシル基、2-(3-フェニルプロポキシ)ベンジル基、3-(3-フェニル プロポキシ)ベンジル基、4-(3-フェニルプロポキシ)ベンジル基、2-10 (4-フェニルブトキシ) ベンジル基、3-(4-フェニルブトキシ) ベンジル 基、4-(4-フェニルブトキシ)ベンジル基、2-アセチルオキシベンジル基、 3-アセチルオキシベンジル基、4-アセチルオキシベンジル基、2-(2-ア セチルオキシフェニル)エチル基、2-(3-アセチルオキシフェニル)エチル 基、2-(4-アセチルオキシフェニル)エチル基、3-(4-アセチルオキシ 15 フェニル)プロピル基、4-(4-アセチルオキシフェニル)ブチル基、5-(4-アセチルオキシフェニル)ペンチル基、6-(4-アセチルオキシフェニ ル) ヘキシル基、2-メタンスルホニルベンジル基、3-メタンスルホニルベン ジル基、4-メタンスルホニルベンジル基、3,4-ジメタンスルホニルベンジ ル基、3,4,5ートリメタンスルホニルベンジル基、2-(2-メタンスルホ ニルフェニル) エチル基、2-(3-メタンスルホニルフェニル) エチル基、2 - (4-メタンスルホニルフェニル)エチル基、3-(4-メタンスルホニルフ ェニル)プロピル基、4-(4-メタンスルホニルフェニル)ブチル基、5-(4-メタンスルホニルフェニル)ペンチル基、6-(4-メタンスルホニルフ ェニル)へキシル基、2-シアノベンジル基、3-シアノベンジル基、4-シア ノベンジル基、2,4-ジシアノベンジル基、3,4,5-トリシアノベンジル 基、2- (2-シアノフェニル)エチル基、2- (3-シアノフェニル)エチル 基、2-(4-シアノフェニル)エチル基、3-(4-シアノフェニル)プロピ ル基、4-(4-シアノフェニル) ブチル基、5-(4-シアノフェニル) ペン

チル基、6-(4-シアノフェニル) ヘキシル基、2-ニトロベンジル基、3-ニトロベンジル基、4-ニトロベンジル基、2,6-ジニトロベンジル基、3,4,5-トリニトロベンジル基、2-(2-ニトロフェニル) エチル基、2-(3-ニトロフェニル) エチル基、2-(3-ニトロフェニル) エチル基、3-5(4-ニトロフェニル) プロピル基、4-(4-ニトロフェニル) ブチル基、5-(4-ニトロフェニル) ペンチル基、6-(4-ニトロフェニル) ヘキシル基、2-(1,2,3-チアジアゾールー4-イル) ベンジル基、3-(1,2,3-チアジアゾールー4-イル) ベンジル基、4-(1,2,3-チアジアゾールー4-イル) ベンジル基等のフェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、0 ハロゲン原子、シアノ基、フェニル基、ニトロ基、C1~6アルキルチオ基、C

10 ハロゲン原子、シアノ基、フェニル基、ニトロ基、C1~6アルキルチオ基、C 1~6アルキルスルホニル基、フェニルC1~6アルコキシ基、C2~6アルカノイルオキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基及び1,2,3ーチアジアゾリル基からなる群より選ばれた基が1~5個好ましくは1~3個置換していてもよい)
 15 を挙げることができる。

C2~C6アルケニル基としては、例えば、ビニル基、2-プロペニル基、3 -ブテニル基、2-ブテニル基、4-ペンテニル基、3-ペンテニル基、5-ヘ キセニル基、4-ヘキセニル基、3-ヘキセニル基等を挙げることができる。

フェニル基(フェニル環上にハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは 未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコ キシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)とし ては、例えば、無置換のフェニル基、上記で定義されたハロゲン原子、シアノ基、 ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未 置換のC1~6アルコキシからなる群より選択された置換基を1~5個、好まし くは1~3個有するフェニル基であって、より具体的には、例えば、フェニル基、 2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、 2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2-ブ ロモフェニル基、3-ブロモフェニル基、4-ブロモフェニル基、2-ヨードフェニル基、3-ヨードフェニル基、4-ゴロモフェニル基、2・3ージフルオロ

フェニル基、3,4-ジフルオロフェニル基、3,5-ジフルオロフェニル基、 2, 4-ジフルオロフェニル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル 基、2、6-ジフルオロフェニル基、2、3-ジクロロフェニル基、3、4-ジ クロロフェニル基、3,5-ジクロロフェニル基、2,4-ジクロロフェニル基、 2,6-ジクロロフェニル基、3,4,5-トリフルオロフェニル基、3,4, 5 5-トリクロロフェニル基、2、4、6-トリフルオロフェニル基、2、4、6 ートリクロロフェニル基、2-メチルフェニル基、3-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2ーメチルー3ークロロフェニル基、3ーメチルー4ークロ ロフェニル基、2-クロロー4-メチルフェニル基、2-メチルー3-フルオロ フェニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、3-トリフルオロメチルフェ 10 ニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、2-ペンタフルオロエチルフェニ ル基、3-ペンタフルオロエチルフェニル基、4-ペンタフルオロエチルフェニ ル基、2-イソプロピルフェニル基、3-イソプロピルフェニル基、4-イソプ ロピルフェニル基、2-tert-ブチルフェニル基、3-tert-ブチルフ ェニル基、4-tert-ブチルフェニル基、2-sec-ブチルフェニル基、 15 3-sec-ブチルフェニル基、4-sec-ブチルフェニル基、2-n-ヘプ タフルオロプロピルフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、 4-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-ペンチルフェニル基、4-ヘ キシルフェニル基、2-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、4-メ 20 トキシフェニル基、3ークロロー2ーメトキシフェニル基、2ーフルオロー3ー メトキシフェニル基、2-フルオロ-4-メトキシフェニル基、2,6-ジメト キシフェニル基、2、3、4ートリフルオロフェニル基、2ーフルオロー4ーブ ロモフェニル基、4ークロロー3ーフルオロフェニル基、2,3,4ートリクロ ロフェニル基、4-n-ブチルフェニル基、2,4-ジメチルフェニル基、2, 3-ジメチルフェニル基、2,6-ジメチルフェニル基、3,5-ジメチルフェ 25ニル基、2,5-ジメチルフェニル基、2,4,6-トリメチルフェニル基、2, 4、6-トリメトキシフェニル基、3、5-ジトリフルオロメチルフェニル基、

4-n-ブトキシフェニル基、2,4-ジメトキシフェニル基、2,3-ジメト

キシフェニル基、3、5-ジメトキシフェニル基、2、5-ジメトキシフェニル

基、3、5-ジトリフルオロメトキシフェニル基、3-クロロー4-メトキシフ ェニル基、2-クロロー4ートリフルオロメトキシフェニル基、3-メチルー4 ーフルオロフェニル基、4ーブロモー3ートリフルオロメチルフェニル基、2-シアノフェニル基、3ーシアノフェニル基、4ーシアノフェニル基、2ートリフ ルオロメトキシフェニル基、3ートリフルオロメトキシフェニル基、4ートリフ ルオロメトキシフェニル基、3-フルオロ-2-トリフルオロメトキシフェニル 基、2-フルオロ-3-トリフルオロメトキシフェニル基、3-フルオロ-4-トリフルオロメトキシフェニル基、3-クロロー2-トリフルオロメトキシフェ ニル基、2ークロロー3ートリフルオロメトキシフェニル基、3ークロロー4ー トリフルオロメトキシフェニル基、2ーペンタフルオロエトキシフェニル基、3 10 ーペンタフルオロエトキシフェニル基、4ーペンタフルオロエトキシフェニル基、 3-クロロ-2-ペンタフルオロエトキシフェニル基、2-クロロ-3-ペンタ フルオロエトキシフェニル基、3-クロロ-4-ペンタフルオロエトキシフェニ ル基、2-イソプロポキシフェニル基、3-イソプロポキシフェニル基、4-イ ソプロポキシフェニル基、2-tert-ブトキシフェニル基、3-tert-15 ブトキシフェニル基、4-tert-ブトキシフェニル基、2-sec-ブトキ シフェニル基、3-sec-ブトキシフェニル基、4-sec-ブトキシフェニ ル基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、3-n-ヘプタフルオロ プロポキシフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-n -ペントキシフェニル基、4-n-ヘキシルオキシフェニル基等を挙げることが 20 できる。

フェニルC 2~6のアルカノイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換して25 いてもよい)としては、例えば、フェニルアセチル基、3ーフェニルプロピオニル基、4ーフェニルブチリル基、5ーフェニルペンタノイル基、6ーフェニルペキサノイル基、4ーフルオロフェニルアセチル基、3ー(4ーフルオロフェニル)プロピオニル基、4ー(4ーフルオロフェニル)ブチリル基、5ー(4ーフルオロフェニル)ペンタノイル基、6ー(4ーフルオロフェニル)ペキサノイルルオロフェニル)ペンタノイル基、6ー(4ーフルオロフェニル)ペキサノイル

基、2-クロロフェニルアセチル基、2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェ ニルアセチル基、3- (2-クロロフェニル)プロピオニル基、4- (2-クロ ロフェニル)ブチリル基、5-(2-クロロフェニル)ペンタノイル基、6-(2-クロロフェニル) ヘキサノイル基、3-クロロフェニルアセチル基、3-(3-クロロフェニル)プロピオニル基、4-(3-クロロフェニルフェニル) ブチリル基、5-(3-クロロフェニル)ペンタノイル基、6-(3-クロロフ ェニル)へキサノイル基、4ークロロフェニルアセチル基、3-(4ークロロフ ェニル)プロピオニル基、4-(4-クロロフェニル)ブチリル基、5-(4-クロロフェニル)ペンタノイル基、6-(4-クロロフェニル)へキサノイル基、 3, 4-ジクロロフェニルアセチル基、3-(3, 4-ジクロロフェニル)プロ 10 ピオニル基、4-(3,4-ジクロロフェニル)ブチリル基、5-(3,4-ジ クロロフェニル)ペンタノイル基、6-(3,4-ジクロロフェニル)へキサノ イル基、2-メチルフェニルアセチル基、3-メチルフェニルアセチル基、4-メチルフェニルアセチル基、(2、4、6-トリメチルフェニル)アセチル基、 (2,6-ジメトキシフェニル)アセチル基、(2,4,5-トリメトキシフェ 15 ニル)アセチル基、(3,5-ジトリフルオロメチルフェニル)アセチル基、 (3, 5-ジトリフルオロメトキシフェニル)アセチル基、2-トリフルオロメ チルフェニルアセチル基、3ートリフルオロメチルフェニルアセチル基、4ート リフルオロメチルフェニルアセチル基、2-フェニルプロピオニル基、3-(2 - メチルフェニル)プロピオニル基、3- (3-メチルフェニル)プロピオニル 20 基、3-(4-メチルフェニル)プロピオニル基、3-(2-トリフルオロメチ ルフェニル)プロピオニル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)プロピ オニル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロピオニル基、3-(3, 5-ジメチルフェニル)プロピオニル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニ ル)ブチリル基、5-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンタノイル基、6 25- (4-トリフルオロメチルフェニル) ヘキサノイル基、4-(4-ペンタフル オロエチルフェニル)ブチリル基、5-(4-ペンタフルオロエチルフェニル) ペンタノイル基、6-(4-ペンタフルオロエチルフェニル)へキサノイル基、

2-メトキシフェニルアセチル基、3-メトキシフェニルアセチル基、4-メト

ることができる。

キシフェニルアセチル基、2-トリフルオロメトキシフェニルアセチル基、3-トリフルオロメトキシフェニルアセチル基、4-トリフルオロメトキシフェニル アセチル基、3-(2-メトキシフェニル)プロピオニル基、3-(3-メトキ シフェニル)プロピオニル基、3-(4-メトキシフェニル)プロピオニル基、 3- (2-トリフルオロメトキシフェニル)プロピオニル基、3- (3-トリフ ルオロメトキシフェニル)プロピオニル基、3-(4-トリフルオロメトキシフ エニル)プロピオニル基、3-(3,5-ジメトキシフェニル)プロピオニル基、 4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ブチリル基、5-(4-トリフルオ ロメトキシフェニル)ペンタノイル基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニ ル) ヘキサノイル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ブチリル基、 10 5- (4-ペンタフルオロエトキシフェニル) ペンタノイル基、6- (4-ペン タフルオロエトキシフェニル) ヘキサノイル基等のフェニルC2~6のアルカノ イル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1 ~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からな る群より選ばれた基 $1\sim5$ 個、好ましくは $1\sim3$ 個置換していてもよい)を挙げ 15

で1~20のアルコキシカルボニル基(アルコキシ基上には、ハロゲン原子、置換基としてC1~6アルキル基を有することのあるアミノ基及びC1~6アルコキシ置換C1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が20 置換していてもよい)とは、置換基としてハロゲン原子、C1~6アルキル基を有することのあるアミノ基及びC1~6アルコキシ置換C1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基を1~7個有していてもよい炭素数1乃至20個のアルコキシ基とカルボニル基で構成される基であって、例えば、メトキシカルボニル基、ホープロポキシカルボニル基、nーブトキシカルボニル基、nープチルオキシカルボニル基、nーペンチルオキシカルボニル基、nーヘキシルオキシカルボニル基、nーヘプチルオキシカルボニル基、nーイクチルオキシカルボニル基、nークチルオキシカルボニル基、nートリデシルオキシカルボニル基、nードデシルオキシカルボニル基、nートリデシルオキシカルボニル基、nートリデシルオキシカルボニル基、nーテトラデシルオキシカルボニル基、nーペンタデシルオキシカルボニル基、nーテトラデシルオキシカルボニル基、nーペンタデシルオキシカルボニル基、nーテトラデシルオキシカルボニル基、nーペンタデシルオキシカルボニル基、nーペンタデシルオキシカルボニル基、nーペンタデシルオキシカルボニル基、nーテトラデシルオキシカルボニル基、nーペンタデシルオキシカルボニル基、nーテトラデシルオキシカルボニル基、nーペンタデシルオキシカルボニル基、nーペンタデシルオキシカルボニル基、nーペンタデシルオキシカルボニル基、nーペンタデシルオキシカルボニル基、nーペンタデシルオキシカルボニル基、nーペンタデシルオキシカルボニル基、nーペンタデシルオキシカルボニル

ニル基、n-ヘキサデシルオキシカルボニル基、n-ヘプタデシルオキシカルボ ニル基、n-オクタデシルオキシカルボニル基、n-ノナデシルオキシカルボニ ル基、n-イコシルオキシカルボニル基、クロロメトキシカルボニル基、トリク ロロメトキシカルボニル基、2-ブロモエトキシカルボニル基、2,2-ジブロ 5 モエトキシカルボニル基、3-フルオロプロポキシカルボニル基、4-ヨードブ トキシカルボニル基、5,5,5,4,4,3,3-ヘプタフルオロペンチルオ キシカルボニル基、4,4,4,3,3,2,2-ヘプタフルオロブトキシカル ボニル基、5-クロロペンチルオキシカルボニル基、6-ブロモヘキシルオキシ カルボニル基、7-クロロヘプチルオキシカルボニル基、8-ヨードオクチルオ 10 キシカルボニル基、9-クロロノニルオキシカルボニル基、10-ブロモデシル オキシカルボニル基、11-フルオロウンデシルオキシカルボニル基、12-ヨ ードドデシルオキシカルボニル基、12-クロロドデシルオキシカルボニル基、 13-フルオロトリデシルオキシカルボニル基、14-ブロモテトラデシルオキ シカルボニル基、15-ヨードペンタデシルオキシカルボニル基、16-クロロ 15 ヘキサデシルオキシカルボニル基、17-ブロモヘプタデシルオキシカルボニル 基、18-フルオロオクタデシルオキシカルボニル基、19-クロロノナデシル オキシカルボニル基、20-クロロイコシルオキシカルボニル基、アミノメトキ シカルボニル基、ジエチルアミノメトキシカルボニル基、2-ジエチルアミノエ トキシカルボニル基、3-ジエチルアミノプロポキシカルボニル基、4-ジエチ 20 ルアミノブキシカルボニル基、5-ジエチルアミノペンチルオキシカルボニル基、 6-ジエチルアミノヘキシルオキシカルボニル基、7-ジエチルアミノヘプチル オキシカルボニル基、8-ジエチルアミノオクチルオキシカルボニル基、9-ジ エチルアミノノニルオキシカルボニル基、10-ジエチルアミノデシルオキシカ ルボニル基、11-ジエチルアミノウンデシルオキシカルボニル基、12-ジエ チルアミノドデシルオキシカルボニル基、13-ジエチルアミノトリデシルオキ シカルボニル基、14-ジエチルアミノテトラデシルオキシカルボニル基、15 ージエチルアミノペンタデシルオキシカルボニル基、16-ジエチルアミノヘキ サデシルオキシカルボニル基、17-ジエチルアミノヘプタデシルオキシカルボ ニル基、18-ジエチルアミノオクタデシルオキシカルボニル基、19-ジェチ

ルアミノノナデシルオキシカルボニル基、20-ジエチルアミノイコシルオキシ カルボニル基、メトキシエトキシメトキシカルボニル基、2-(2-エトキシエ トキシ) エトキシカルボニル基、2-(2-プロポキシエトキシ) エトキシカル ボニル基、2-(2-ブトキシエトキシ)エトキシカルボニル基、2-(2-ペ ンチルオキシエトキシ)エトキシカルボニル基、2-(2-ヘキシルオキシエト キシ)エトキシカルボニル基、2-メトキシエトキシエトキシカルボニル基、3 ー (3-メトキシプロポキシ) プロポキシカルボニル基、4-(4-メトキシブ トキシ)ブトキシカルボニル基、5-(5-メトキシペンチルオキシ)ペンチル オキシカルボニル基、6-(6-メトキシヘキシルオキシ)ヘキシルオキシカル ボニル基、7-(2-メトキシエトキシ)ヘプチルオキシカルボニル基、8-10 (1-メトキシエトキシ)オクチルオキシカルボニル基、9-(1-メトキシエ トキシ)ノニルオキシカルボニル基、10-(2-メトキシエトキシ)デシルオ キシカルボニル基、11-(1-メトキシエトキシ)ウンデシルオキシカルボニ ル基、12-(2-メトキシエトキシ)ドデシルオキシカルボニル基、12-15 (1-メトキシエトキシ)ドデシルオキシカルボニル基、13-(2-メトキシ エトキシ) トリデシルオキシカルボニル基、14-(1-メトキシエトキシ) テ トラデシルオキシカルボニル基、15-(2-メトキシエトキシ)ペンタデシルオ キシカルボニル基、16-(1-メトキシエトキシ)へキサデシルオキシカルボ ニル基、17-(2-メトキシエトキシ)へプタデシルオキシカルボニル基、1 20 8- (1-メトキシエトキシ) オクタデシルオキシカルボニル基、19- (2-メトキシエトキシ) ノナデシルオキシカルボニル基、20-(1-メトキシエト キシ)イコシルオキシカルボニル基、ジメチルアミノメトキシカルボニル基、2 -メチルアミノエトキシカルボニル基、3-(N-メチル-N-ブチルアミノ) プロポキシカルボニル基、4-プロピルアミノブキシキシカルボニル基、5-へ キシルアミノペンチルオキシカルボニル基、6-ペンチルアミノヘキシルオキシ 25 カルボニル基、7- (N-エチル-N-プロピルアミノ) ヘプチルオキシカルボ ニル基、8-(N-プロピル-N-ヘキシル)アミノオクチルオキシカルボニル 基、9-(N-ペンチル-N-メチルアミノ)ノニルオキシカルボニル基、10

ージプロピルアミノデシルオキシカルボニル基、11-ジペンチルアミノウンデ

シルオキシカルボニル基、12-ジヘキシルアミノドデシルオキシカルボニル基、12-ジブチルアミノドデシルオキシカルボニル基、13-(N-エチル-N-ブチルアミノ)トリデシルオキシカルボニル基、14-(N-メチル-N-ヘキシルアミノ)テトラデシルオキシカルボニル基、15-ジメチルアミノペンタデシルオキシカルボニル基、16-ジメチルアミノヘキサデシルオキシカルボニル基、17-ジメチルアミノヘプタデシルオキシカルボニル基、18-ジメチルアミノオクタデシルオキシカルボニル基、19-ジメチルアミノノナデシルオキシカルボニル基、20-ジメチルアミノイコシルオキシカルボニル基等を挙げることができる。

10 フェニルC1~6アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、 ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置 換のC1~6アルコキシ基、ニトロ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6 アルキルチオ基、C1~6アルカノイル基を有することのあるアミノ基、フェニ ν C1~6アルコキシ基、C1~6アルコキシカルボニル基及び1,2,3-チ アジアゾリル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよ 15 い)としては、例えば、ベンジルオキシカルボニルオキシカルボニル基、1-フ エネチルオキシカルボニル基、2-フェネチルオキシカルボニル基、3-フェニ ルプロポキシカルボニル基、2-フェニルプロポキシカルボニル基、4-フェニ ルブトキシカルボニル基、5-フェニルペンチルオキシカルボニル基、4-フェ 20 ニルペンチルオキシカルボニル基、6-フェニルヘキシルオキシカルボニル基、 2-フルオロベンジルオキシカルボニル基、3-フルオロベンジルオキシカルボ . ニル基、4-フルオロベンジルオキシカルボニル基、2-クロロベンジルオキシ カルボニル基、3-クロロベンジルオキシカルボニル基、4-クロロベンジルオ キシカルボニル基、2-ブロモベンジルオキシカルボニル基、3-ブロモベンジ ルオキシカルボニル基、4ーブロモベンジルオキシカルボニル基、2-ヨードベ ンジルオキシカルボニル基、3-ヨードベンジルオキシカルボニル基、4-ヨー ドベンジルオキシカルボニル基、2,3-ジフルオロベンジルオキシカルボニル 基、3、4ージフルオロベンジルオキシカルボニル基、3、5ージフルオロベン ジルオキシカルボニル基、2,4-ジフルオロベンジルオキシカルボニル基、2,

6-ジフルオロベンジルオキシカルボニル基、2,4,6-トリフルオロベンジ ルオキシカルボニル基、3、4、5ートリフルオロベンジルオキシカルボニル基、 2, 3-ジクロロベンジルオキシカルボニル基、3, 4-ジクロロベンジルオキ シカルボニル基、3,5-ジクロロベンジルオキシカルボニル基、2,4-ジク ロロベンジルオキシカルボニル基、2,6-ジクロロベンジルオキシカルボニル 5 基、2、4、6-トリクロロベンジルオキシカルボニル基、3、4、5-トリク ロロベンジルオキシカルボニル基、2,3,4,5,6-ペンタフルオロベンジ ルオキシカルボニル基、2-ジフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、3 - ジフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、4 - ジフルオロメチルベンジ 10 ルオキシカルボニル基、4-クロロー3-ジフルオロメチルベンジルオキシカル ボニル基、3-クロロー4-ジフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、3 ーブロモー4ージフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、3,5ージフル オロー4ージフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、2ートリフルオロメ チルベンジルオキシカルボニル基、2-フルオロ-4-ブロモベンジルオキシカ ルボニル基、4ークロロー3ーフルオロベンジルオキシカルボニル基、2,3, 15 4-トリクロロベンジルオキシカルボニル基、4-イソプロピルベンジルオキシ カルボニル基、4-n-ブチルベンジルオキシカルボニル基、4-メチルベンジ ルオキシカルボニル基、2-メチルベンジルオキシカルボニル基、3-メチルベ ンジルオキシカルボニル基、2,4-ジメチルベンジルオキシカルボニル基、2, 3-ジメチルベンジルオキシカルボニル基、2,6-ジメチルベンジルオキシカ 20 ルボニル基、3,5-ジメチルベンジルオキシカルボニル基、2,5-ジメチル ベンジルオキシカルボニル基、2,4,6-トリメチルベンジルオキシカルボニ ル基、3,5-ジトリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、4-イソプ ロポキシベンジルオキシカルボニル基、4-n-ブトキシベンジルオキシカルボ ニル基、4-メトキシベンジルオキシカルボニル基、2-メトキシベンジルオキ 25 シカルボニル基、3-メトキシベンジルオキシカルボニル基、2、4-ジメトキ シベンジルオキシカルボニル基、2,3-ジメトキシベンジルオキシカルボニル 基、2,6-ジメトキシベンジルオキシカルボニル基、3,5-ジメトキシベン ジルオキシカルボニル基、2,5-ジメトキシベンジルオキシカルボニル基、2,

4, 6-トリメトキシベンジルオキシカルボニル基、3, 5-ジトリフルオロメ トキシベンジルオキシカルボニル基、2-イソプロポキシベンジルオキシカルボ ニル基、3-クロロー4-メトキシベンジルオキシカルボニル基、2-クロロー 4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、3-メチル-4-フル オロベンジルオキシカルボニル基、4-ブロモ-3-トリフルオロメチルベンジ ルオキシカルボニル基、3-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、 4-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、4-フルオロ-3-トリ フルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、3-フルオロ-4-トリフルオロ メチルベンジルオキシカルボニル基、2-ペンタフルオロエチルベンジルオキシ カルボニル基、4-クロロー3-ペンタフルオロエチルベンジルオキシカルボニ 10 ル基、3-クロロー4-ペンタフルオロエチルベンジルオキシカルボニル基、3 -ペンタフルオロエチルベンジルオキシカルボニル基、4-ペンタフルオロエチ ルベンジルオキシカルボニル基、2-トリフルオロメトキシベンジルオキシカル ボニル基、3ートリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、4ートリフ ルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、4-フルオロー3-トリフルオロ 15 メトキシベンジルオキシカルボニル基、3-フルオロ-4-トリフルオロメトキ シベンジルオキシカルボニル基、2-ペンタフルオロエトキシベンジルオキシカ ルボニル基、3ーペンタフルオロエトキシベンジルオキシカルボニル基、4ーペ ンタフルオロエトキシベンジルオキシカルボニル基、3-クロロー4-トリフル オロメトキシベンジルオキシカルボニル基、3-クロロー4ーペンタフルオロエ 20 トキシベンジルオキシカルボニル基、2-(2-トリフルオロメチルフェニル) エトキシカルボニル基、2-(3-トリフルオロメチルフェニル) エトキシカル ボニル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エトキシカルボニル基、 (2-トリフルオロメトキシフェニル) メトキシカルボニル基、 (3-トリフル

(2-トリフルオロメトキシフェニル)メトキシカルボニル基、(3-トリフル 25 オロメトキシフェニル)メトキシカルボニル基、2-(4-トリフルオロメトキ シフェニル)エトキシカルボニル基、2-(2-ペンタフルオロエトキシフェニ ル)エトキシカルボニル基、2-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)エト キシカルボニル基、2-(4-ペンタフルオロエトキシフェニル)エトキシカル ボニル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシカルボニル基、

3- (3-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(2-トリフルオ ロメトキシフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(3-トリフルオロメトキ シフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニ 5 ル)プロポキシカルボニル基、3-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)プ ロポキシカルボニル基、3-(4-ペンタフルオロエトキシフェニル)プロポキ シカルボニル基、4-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)ブトキシカルボ ニル基、5-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチルオキシカルボニル基、 4- (4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチルオキシカルボニル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(3 10 - トリフルオロメチルフェニル) ヘキシルオキシカルボニル基、6-(4-トリ フルオロメチルフェニル) ヘキシルオキシカルボニル基、6-(4-トリフルオ ロメトキシフェニル) ヘキシルオキシカルボニル基、2-メチルチオベンジルオ キシカルボニル基、3-メチルチオベンジルオキシカルボニル基、4-メチルチ オベンジルオキシカルボニル基、2-(2-メチルチオフェニル)エトキシカル ボニル基、2-(3-メチルチオフェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-メチルチオフェニル)エトキシカルボニル基、3-(4-メチルチオフェニル) プロポキシカルボニル基、4-(4-メチルチオフェニル)ブトキシカルボニル 基、5-(4-メチルチオフェニル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(4-メチルチオフェニル) ヘキシルオキシカルボニル基、2ートリフルオロメチルチ 20 オベンジルオキシカルボニル基、3-トリフルオロメチルチオベンジルオキシカ ルボニル基、4ートリフルオロメチルチオベンジルオキシカルボニル基、2-(2-トリフルオロメチルチオフェニル) エトキシカルボニル基、2-(3-ト リフルオロメチルチオフェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-トリフルオ ロメチルチオフェニル)エトキシカルボニル基、3-(4-トリフルオロメチル 25 チオフェニル)プロポキシカルボニル基、4-(4-トリフルオロメチルチオフ ェニル) ブトキシカルボニル基、5-(4-トリフルオロメチルチオフェニル) ペンチルオキシカルボニル基、6-(4-トリフルオロメチルチオフェニル)へ キシルオキシカルボニル基、2-ベンジルオキシベンジルオキシカルボニル基、

3 - ベンジルオキシベンジルオキシカルボニル基、4 - ベンジルオキシベンジル オキシカルボニル基、2- (2-ベンジルオキシフェニル) メトキシカルボニル 基、2-(3-ベンジルオキシフェニル)メトキシカルボニル基、2-(4-ベ ンジルオキシフェニル) メトキシカルボニル基、3-(4-ベンジルオキシフェ ニル)プロポキシカルボニル基、4-(4-ベンジルオキシフェニル)ブトキシ カルボニル基、5-(4-ベンジルオキシフェニル)ペンチルオキシカルボニル 基、6-(4-ベンジルオキシフェニル)へキシルオキシカルボニル基、2-(2-フェニルエトキシ) ベンジルオキシカルボニル基、3-(2-フェニルエ トキシ)ベンジルオキシカルボニル基、4-(2-フェニルエトキシ)ベンジル オキシカルボニル基、2- (2- (2-フェニルエトキシ) フェニル) エトキシ カルボニル基、2-(3-(2-フェニルエトキシ)フェニル)エトキシカルボ ニル基、2-(4-(2-フェニルエトキシ)フェニル)エトキシカルボニル基、 3-(4-(2-フェニルエトキシ)フェニル)プロポキシカルボニル基、4-(4-(2-フェニルエトキシ)フェニル)ブトキシカルボニル基、5-(4-(2-フェニルエトキシ) フェニル) ペンチルオキシカルボニル基、6-(4-15 (2-フェニルエトキシ) フェニル) ヘキシルオキシカルボニル基、2-(3-フェニルプロポキシ)ベンジルオキシカルボニル基、3- (3-フェニルプロポ キシ)ベンジルオキシカルボニル基、4-(3-フェニルプロポキシ)ベンジル オキシカルボニル基、2-(4-フェニルブトキシ)ベンジルオキシカルボニル 20 基、3-(4-フェニルブトキシ)ベンジルオキシカルボニル基、4-(4-フ ェニルブトキシ) ベンジルオキシカルボニル基、2-メトキシカルボニルベンジ ルオキシカルボニル基、3-メトキシカルボニルベンジルオキシカルボニル基、 4-メトキシカルボニルベンジルオキシカルボニル基、2-(2-メトキシカル ボニルフェニル) エトキシカルボニル基、2-(3-メトキシカルボニルフェニ ル) エトキシカルボニル基、2-(4-メトキシカルボニルフェニル) エトキシ 25カルボニル基、3- (4-メトキシカルボニルフェニル)プロポキシカルボニル 基、4--(4-メトキシカルボニルフェニル)ブトキシカルボニル基、5--(4 ーメトキシカルボニルフェニル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(4-メト

キシカルボニルフェニル)ヘキシルオキシカルボニル基、2-ブチリルアミノベ

ンジルオキシカルボニル基、3-ブチリルアミノベンジルオキシカルボニル基、 4-ブチリルアミノベンジルオキシカルボニル基、2-(2-ブチリルアミノフ ェニル) エトキシカルボニル基、2- (3-ブチリルアミノフェニル) エトキシ カルボニル基、2-(4-ブチリルアミノフェニル)エトキシカルボニル基、3 5 - (4-ブチリルアミノフェニル)プロポキシカルボニル基、4-(4-ブチリ ルアミノフェニル) ブトキシカルボニル基、5-(4-ブチリルアミノフェニ ル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(4-ブチリルアミノフェニル)へキシ ルオキシカルボニル基、2-ニトロベンジルオキシカルボニル基、3-ニトロベ ンジルオキシカルボニル基、4-ニトロベンジルオキシカルボニル基、2-(2 ---トロフェニル) エトキシカルボニル基、2-(3-ニトロフェニル) エトキ 10 シカルボニル基、2-(2,4-ジニトロフェニル)エトキシカルボニル基、2 - (2, 4, 6-トリニトロフェニル) エトキシカルボニル基、2-(4-ニト ロフェニル) エトキシカルボニル基、3-(4-ニトロフェニル) プロポキシカ ルボニル基、4-(4-ニトロフェニル)ブトキシカルボニル基、5-(4-ニ トロフェニル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(4-ニトロフェニル)へキ 15 シルオキシカルボニル基、2-アミノベンジルオキシカルボニル基、3-アミノ ベンジルオキシカルボニル基、4ーアミノベンジルオキシカルボニル基、2-(2-アミノフェニル) エトキシカルボニル基、2-(3-アミノフェニル) エ トキシカルボニル基、2-(4-アミノフェニル)エトキシカルボニル基、3-(4-アミノフェニル) プロポキシカルボニル基、4-(4-アミノフェニル) 20 ブトキシカルボニル基、5-(4-アミノフェニル)ペンチルオキシカルボニル 基、6-(4-アミノフェニル) ヘキシルオキシカルボニル基、2-アセチルア ミノベンジルオキシカルボニル基、3-プロピオニルアミノベンジルオキシカル ボニル基、4ーペンタノイルアミノベンジルオキシカルボニル基、2ー(2ーへ キサノイルアミノフェニル)エトキシカルボニル基、2-(3-アセチルアミノ 25 フェニル) エトキシカルボニル基、2-(4-アセチルアミノフェニル) エトキ シカルボニル基、3-(4-アセチルアミノフェニル)プロポキシカルボニル基、 4-(4-アセチルアミノフェニル)ブトキシカルボニル基、5-(4-アセチ ルアミノフェニル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(4-アセチルアミノフ

ェニル) ヘキシルオキシカルボニル基、2-エトキシカルボニルベンジルオキシ カルボニル基、3-エトキシカルボニルベンジルオキシカルボニル基、4-エト キシカルボニルベンジルオキシカルボニル基、2-(2-エトキシカルボニルフ エニル) エトキシカルボニル基、2-(3-ブトキシカルボニルフェニル) エト 5 キシカルボニル基、2-(4-プロポキシカルボニルフェニル)エトキシカルボ ニル基、3-(4-エトキシカルボニルフェニル)プロポキシカルボニル基、4 - (4-ペンチルオキシカルボニルフェニル)ブトキシカルボニル基、5-(4 - ヘキシルオキシカルボニルフェニル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(4 ーエトキシカルボニルフェニル) ヘキシルオキシカルボニル基、2-(1,2, 10 3-チアジアゾール-4-イル) ベンジルオキシカルボニル基、3-(1, 2, 3-チアジアゾールー4-イル) ベンジルオキシカルボニル基、4-(1,2, 3-チアジアゾール-4-イル) ベンジルオキシカルボニル基等のフェニルC1 ~6アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換 もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6 アルコキシ基、ニトロ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキルチオ 15 基、C1~6アルカノイル基を1~2個有することのあるアミノ基、フェニルC 1~6アルコキシ基、C1~6アルコキシカルボニル基及び1,2,3-チアジ アゾール基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは、1~3個置換し

20 フェニルC3~6アルケニルオキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)とは、無置換フェニル基又はハロゲン原子、ハロゲンC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基から選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換されたフェニル基と炭素数3から6二重結合を1~3個有するアルケニルオキシ基とカルボニル基から構成される基である。フェニルC3~6アルケニルオキシカルボニル基は、トランス体及びシス体の両者を包含する。このようなフェニルC3~6アルケニルオキシカルボニル基としては、例えば、無置換の3-フェニル-2-プロペニルオキシカルボニル基としては、例えば、無置換の3-フェニル-2-プロペニルオキシカ

ていてもよい)を挙げることができる。

ルボニル基(慣用名:シンナミルオキシカルボニル基)、4-フェニル-2-ブ テニルオキシカルボニル基、4-フェニル-3-ブテニルオキシカルボニル基、 5-フェニル-2-ペンテニルオキシカルボニル基、5-フェニル-4-ペンテ ニルオキシカルボニル基、5-フェニル-3-ペンテニルオキシカルボニル基、

- 5 6-フェニルー5-ヘキセニルオキシカルボニル基、6-フェニルー4-ヘキセニルオキシカルボニル基、6-フェニルー3-ヘキセニルオキシカルボニル基、4-フェニルー1,3-ブタジエニルオキシカルボニル基、6-フェニルー1,3,5-ヘキサトリエニルオキシカルボニル基、6-フェニルー3-ヘキセニルオキシカルボニル基、3-(2-フルオロフェニル)-2-プロペニルオキシカ
- 10 ルボニル基、3-(3-フルオロフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(4-フルオロフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(2,3-ジフルオロフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-
 - (2, 4-ジフルオロフェニル) -2-プロペニルオキシカルボニル基、3-
 - (3,4-ジフルオロフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-
- 15 (3,5ージフルオロフェニル) -2ープロペニルオキシカルボニル基、3-(2-クロロフェニル) -2ープロペニルオキシカルボニル基、3-(3-クロロフェニル) -2ープロペニルオキシカルボニル基、3-(4-クロロフェニル) -2ープロペニルオキシカルボニル基、3-(2,3-ジクロロフェニル) -2ープロペニルオキシカルボニル基、3-(2,4-ジクロロフェニル) -2
- 20 ープロペニルオキシカルボニル基、3 (3, 4 ジクロロフェニル) 2 プロペニルオキシカルボニル基、3 (3, 5 ジクロロフェニル) 2 プロペニルオキシカルボニル基、3 (2 ブロモフェニル) 2 プロペニルオキシカルボニル基、3 (3 ブロモフェニル) 2 プロペニルオキシカルボニル基、3 (4 ブロモフェニル) 2 プロペニルオキシカルボニル基、3 -
- 25 (2-7)ルオロー4ーブロモフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、 3-(2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(4-クロロー3-フルオロフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(2,3,4-トリクロロフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(2,4,6-トリクロロフェニル)-2-プロペニ

ルオキシカルボニル基、3-(4-イソプロピルフェニル)-2-プロペニルオ キシカルボニル基、3-(4-n-ブチルフェニル)-2-プロペニルオキシカ ルボニル基、3-(2,4-ジメチルフェニル)-2-プロペニルオキシカルボ ニル基、3-(2,3-ジメチルフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル 基、3-(2,6-ジメチルフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、 3-(3,5-ジメチルフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-

- (2, 5-ジメチルフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(2,
- 4, 6-トリメチルフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(3,
- 5-ジトリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3
- (4-n-ブトキシフェニル) -2-プロペニルオキシカルボニル基、3-10
 - (2, 4-ジメトキシフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-
 - (2, 3-ジメトキシフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-
 - (2, 6-ジメトキシフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-
 - (3, 5-ジメトキシフェニル) -2-プロペニルオキシカルボニル基、3-
- (2, 5-ジメトキシフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-15
- (3, 5-ジトリフルオロメトキシフェニル) -2-プロペニルオキシカルボニ ル基、3-(3-クロロー4-メトキシフェニルー2-プロペニルオキシカルボ ニル基、3-(2-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェニル)-2-プロペ ニルオキシカルボニル基、3-(3-メチル-4-フルオロフェニル)-2-プ
- 20 ロペニルオキシカルボニル基、3-(4-ブロモ-3-トリフルオロメチルフェ ニル) -2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(2-メチルフェニル)-2 -プロペニルオキシカルボニル基、3-(3-メチルフェニル)-2-プロペニ ルオキシカルボニル基、3-(4-メチルフェニル)-2-プロペニルオキシカ
 - ルボニル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルオキシ
- カルボニル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルオキ 25 シカルボニル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルオ キシカルボニル基、3-(2-トリフルオロメトキシフェニル)-2-プロペニ ルオキシカルボニル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェニル)-2-プロ

ペニルオキシカルボニル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-2-

プロペニルオキシカルボニル基、3-(2-メトキシフェニル)-2-プロペニ ルオキシカルボニル基、3-(3-メトキシフェニル)-2-プロペニルオキシ カルボニル基、3-(4-メトキシフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニ ル基、3-(3,4-ジメトキシフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル 基、4-(4-クロロフェニル)-2-ブテニルオキシカルボニル基、4-(4 ークロロフェニル) -3-ブテニルオキシカルボニル基、5-(4-クロロフェ ニル) -2-ペンテニルオキシカルボニル基、5-(4-クロロフェニル)-4 ーペンテニルオキシカルボニル基、5-(4-クロロフェニル)-3-ペンテニ ルオキシカルボニル基、6-(4-クロロフェニル)-5-ヘキセニルオキシカ ルボニル基、6-(4-クロロフェニル)-4-ヘキセニルオキシカルボニル基、 10 6- (4-クロロフェニル) - 3-ヘキセニルオキシカルボニル基、6-(4-クロロフェニル) -2-ヘキセニルオキシカルボニル基等を挙げることができる。 フェノキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換も しくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6ア ルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換してもよい)とし 15 ては、例えば、フェノキシカルボニル基、2-フルオロフェノキシカルボニル基、 3-フルオロフェノキシカルボニル基、2,3,4,5,6-ペンタフルオロフ ェノキシカルボニル基、4ーフルオロフェノキシカルボニル基、2-クロロフェ ノキシカルボニル基、3ークロロフェノキシカルボニル基、4ークロロフェノキ シカルボニル基、2、3-ジクロロフェノキシカルボニル基、3、4-ジクロロ 20 フェノキシカルボニル基、3,5-ジクロロフェノキシカルボニル基、2-ブロ モフェノキシカルボニル基、3ーブロモフェノキシカルボニル基、4ーブロモフ ェノキシカルボニル基、2-メチルフェノキシカルボニル基、3-メチルフェノ キシカルボニル基、4-メチルフェノキシカルボニル基、2-エチルフェノキシ カルボニル基、3-エチルシフェノキシカルボニル基、4-エチルフェノキシカ 25 ルボニル基、4-プロピルフェノキシカルボニル基、4-tertーブチルフェ ノキシカルボニル基、4ーブチルフェノキシカルボニル基、2,3ージメチルフ ェノキシカルボニル基、3、4、5ートリメチルフェノキシカルボニル基、4ー ペンチルフェノキシカルボニル基、4-ヘキシルフェノキシカルボニル基、2-

フルオロー4ーブロモフェノキシカルボニル基、4ークロロー3ーフルオロフェ ノキシカルボニル基、2,3,4-トリクロロフェノキシカルボニル基、2,4, 6-トリクロロフェノキシカルボニル基、4-イソプロピルフェノキシカルボニ ル基、4-n-ブチルフェノキシカルボニル基、2,4-ジメチルフェノキシカ 5 ルボニル基、2,6-ジメチルフェノキシカルボニル基、3,5-ジメチルフェ ノキシカルボニル基、2,5-ジメチルフェノキシカルボニル基、2,4,6-トリメチルフェノキシカルボニル基、3,5-ジトリフルオロメチルフェノキシ カルボニル基、4-n-ブトキシフェノキシカルボニル基、2,4-ジメトキシ フェノキシカルボニル基、2,3-ジメトキシフェノキシカルボニル基、2,6 10 - - ジメトキシフェノキシカルボニル基、3, 5 - ジメトキシフェノキシカルボニ ル基、2,5-ジメトキシフェノキシカルボニル基、3,5-ジトリフルオロメ トキシフェノキシカルボニル基、3ークロロー4ーメトキシフェノキシカルボニ ル基、2-クロロー4-トリフルオロメトキシフェノキシカルボニル基、3-メ チルー4ーフルオロフェノキシカルボニル基、4ーブロモー3ートリフルオロメ チルフェノキシカルボニル基、2-トリフルオロメチルフェノキシカルボニル基、 15 3-トリフルオロメチルフェノキシカルボニル基、4-トリフルオロメチルフェ ノキシカルボニル基、2-ペンタフルオロエチルフェノキシカルボニル基、3-ペンタフルオロエチルシフェノキシカルボニル基、4ーペンタフルオロエチルフ ェノキシカルボニル基、2-メトキシフェノキシカルボニル基、3-メトキシフ ェノキシカルボニル基、4-メトキシフェノキシカルボニル基、2-エトキシフ 20 ェノキシカルボニル基、3-エトキシフェノキシカルボニル基、4-エトキシフ ェノキシカルボニル基、4ープロポキシフェノキシカルボニル基、4-tert ーブトキシフェノキシカルボニル基、4-n-ブトキシフェノキシカルボニル基、 3,4,5-トリメトキシフェノキシカルボニル基、4ーペントキシフェノキシ カルボニル基、4ーヘキシルオキシフェノキシカルボニル基、2ートリフルオロ 25 メトキシフェノキシカルボニル基、3-トリフルオロメトキシフェノキシカルボ ニル基、4-トリフルオロメトキシフェノキシカルボニル基、2-ペンタフルオ ロエトキシフェノキシカルボニル基、3ーペンタフルオロエトキシフェノキシカ ルボニル基、4ーペンタフルオロエトキシフェノキシカルボニル基等のフェノキ

シカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置 換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基 からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換してもよい)を 挙げることができる。

- 5 フェニルC1~6アルキルカルバモイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、 ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未 置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換 されていてもよい)としては、例えば、ベンジルカルバモイル基、2-フェネチ ルカルバモイル基、3-フェニルプロピルカルバモイル基、2-フェニルプロピ ルカルバモイル基、4-フェニルブチルカルバモイル基、5-フェニルペンチル 10 カルバモイル基、4-フェニルペンチルカルバモイル基、6-フェニルヘキシル カルバモイル基、2-フルオロベンジルカルバモイル基、3-フルオロベンジル カルバモイル基、4ーフルオロベンジルカルバモイル基、2-クロロベンジルカ ルバモイル基、3-クロロベンジルカルバモイル基、4-クロロベンジルカルバ 15 モイル基、2-ブロモベンジルカルバモイル基、3-ブロモベンジルカルバモイ ル基、4ーブロモベンジルカルバモイル基、2-ヨードベンジルカルバモイル基、 3-ヨードベンジルカルバモイル基、4-ヨードベンジルカルバモイル基、N-ベンジルーN-メチルカルバモイル基、N-メチル-N-(2-フェネチル)カ ルバモイル基、N-メチル-N-(3-フェニルプロピル)カルバモイル基、N 20 ーメチルーNー(2ーフェニルプロピル)カルバモイル基、NーメチルーNー (4-フェニルブチル)カルバモイル基、N-メチル-N-(5-フェニルペン チル)カルバモイル基、N-メチル-N-(4-フェニルペンチル)カルバモイ ル基、N-メチル-N-(6-フェニルヘキシル) カルバモイル基、N-(2-フルオロベンジル)-N-メチルカルバモイル基、N-(3-フルオロベンジ ル) - N-メチルカルバモイル基、N-(4-フルオロベンジル) - N-メチル 25 カルバモイル基、N-(2-クロロベンジル)-N-メチルカルバモイル基、N (3-クロロベンジル)-Nーメチルカルバモイル基、N-(4-クロロベン
- ジル) N メチルカルバモイル基、N (2 ブロモベンジル) N メチル カルバモイル基、N-(3-ブロモベンジル)-N-メチルカルバモイル基、N

(4-ブロモベンジル)-N-メチルカルバモイル基、N、N-ジベンジルカ ルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-フェネチル)カルバモイル基、N-ベ ンジルー (3-フェニルプロピル) カルバモイル基、N-ベンジル-N- (2-フェニルプロピル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(4-フェニルブチ 5 ル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(5-フェニルペンチル) カルバモイ ル基、N-ベンジル-N-(4-フェニルペンチル)カルバモイル基、N-ベン ジル-N-(6-フェニルヘキシル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2 ーフルオロベンジル)カルバモイル基、NーベンジルーNー(3ーフルオロベン ジル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(4-フルオロベンジル)カルバモ イル基、NーベンジルーNー(2ークロロベンジル)カルバモイル基、Nーベン 10 ジル-N- (3-クロロベンジル) カルバモイル基、N-ベンジル-N- (4-クロロベンジル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-ブロモベンジル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3-ブロモベンジル)カルバモイル基、 N-ベンジル-N-(4-ブロモベンジル)カルバモイル基、2,3-ジフルオ ロベンジルカルバモイル基、3,4-ジフルオロベンジルカルバモイル基、3, 15 5-ジフルオロベンジルカルバモイル基、2,4-ジフルオロベンジルカルバモ イル基、2,6-ジフルオロベンジルカルバモイル基、2,3-ジクロロベンジ ルカルバモイル基、3,4-ジクロロベンジルカルバモイル基、3,5-ジクロ ロベンジルカルバモイル基、2、4-ジクロロベンジルカルバモイル基、2、6 - ジクロロベンジルカルバモイル基、2-フルオロ-4-ブロモベンジルカルバ 20 モイル基、4-クロロ-3-フルオロベンジルカルバモイル基、2,3,4-ト リクロロベンジルカルバモイル基、3、4、5-トリフルオロベンジルカルバモ イル基、2,4,6-トリクロロベンジルカルバモイル基、4-イソプロピルベ ンジルカルバモイル基、4-n-ブチルベンジルカルバモイル基、4-メチルベ ンジルカルバモイル基、2-メチルベンジルカルバモイル基、3-メチルベンジ 25 ルカルバモイル基、2、4-ジメチルベンジルカルバモイル基、2、3-ジメチ ルベンジルカルバモイル基、2,6-ジメチルベンジルカルバモイル基、3,5 ジメチルベンジルカルバモイル基、2,5-ジメチルベンジルカルバモイル基、 2、4、6-トリメチルベンジルカルバモイル基、3、5-ジトリフルオロメチ

ルベンジルカルバモイル基、4-イソプロポキシベンジルカルバモイル基、4n-ブトキシベンジルカルバモイル基、4-メトキシベンジルカルバモイル基、 2-メトキシベンジルカルバモイル基、3-メトキシベンジルカルバモイル基、 2, 4-ジメトキシベンジルカルバモイル基、2, 3-ジメトキシベンジルカル バモイル基、2,6-ジメトキシベンジルカルバモイル基、3,5-ジメトキシ ベンジルカルバモイル基、2,5-ジメトキシベンジルカルバモイル基、2,4, 6-トリメトキシベンジルカルバモイル基、3,5-ジトリフルオロメトキシベ ンジルカルバモイル基、2-イソプロポキシベンジルカルバモイル基、3-クロ ロー4ーメトキシベンジルカルバモイル基、2ークロロー4ートリフルオロメト キシベンジルカルバモイル基、3-メチル-4-フルオロベンジルカルバモイル 10 基、4-ブロモー3-トリフルオロメチルベンジルカルバモイル基、2-トリフ ルオロメトキシベンジルカルバモイル基、3-トリフルオロメチルベンジルカル バモイル基、4-トリフルオロメチルベンジルカルバモイル基、2-ペンタフル オロエチルベンジルカルバモイル基、3ーペンタフルオロエチルベンジルカルバ モイル基、4ーペンタフルオロエチルベンジルカルバモイル基、2-トリフルオ ロメトキシベンジルカルバモイル基、3-トリフルオロメトキシベンジルカルバ モイル基、4-トリフルオロメトキシベンジルカルバモイル基、2-ペンタフル オロエトキシベンジルカルバモイル基、3ーペンタフルオロエトキシベンジルカ ルバモイル基、4-ペンタフルオロエトキシベンジルカルバモイル基、2-(2 ートリフルオロメチルフェニル) エチルカルバモイル基、2-(3-トリフルオ 20 ロメチルフェニル) エチルカルバモイル基、2-(4-トリフルオロメチルフェ ニル) エチルカルバモイル基、2-(2-トリフルオロメトキシフェニル) エチ ルカルバモイル基、2-(3-トリフルオロメトキシフェニル)エチルカルバモ イル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニル) エチルカルバモイル基、2 - (2-ペンタフルオロエトキシフェニル) エチルカルバモイル基、2- (3-25ペンタフルオロエトキシフェニル) エチルカルバモイル基、2- (4-ペンタフ ルオロエトキシフェニル) エチルカルバモイル基、3-(2-トリフルオロメチ ルフェニル)プロピルカルバモイル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニ ル)プロピルカルバモイル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロピ

ルカルバモイル基、3-(2-トリフルオロメトキシフェニル) プロピルカルバ モイル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェニル)プロピルカルバモイル基、 3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)プロピルカルバモイル基、3-(3 ーペンタフルオロエトキシフェニル)プロピルカルバモイル基、3-(4-ペン タフルオロエトキシフェニル)プロピルカルバモイル基、4-(3-ペンタフル オロエトキシフェニル)ブチルカルバモイル基、5-(4-トリフルオロメチル フェニル)ペンチルカルバモイル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル) ペンチルカルバモイル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ペンチル カルバモイル基、6-(3-トリフルオロメチルフェニル) ヘキシルカルバモイ ル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル) ヘキシルカルバモイル基、6-10 (4-トリフルオロメトキシフェニル) ヘキシルカルバモイル基等のフェニルC 1~6アルキルカルバモイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置 換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1 ~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置 換されていてもよい)を挙げることができる。

ベンゾフリル置換C1~6アルコキシカルボニル基(ベンゾフラン環上には、 少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい。)としては、例えば、2 ーベンゾフリルメトキシカルボニル基、1-(2-ベンゾフリル)エトキシカル ボニル基、2-(4-ベンゾフリル)エトキシカルボニル基、3-(5-ベンゾ フリル)プロポキシカルボニル基、4-(6-ベンゾフリル)ブトキシカルボニ 20 ル基、5- (7-ベンゾフリル) ペンチルオキシカルボニル基、6- (2-ベン ゾフリル) ヘキシルオキシカルボニル基、4-フルオロ-2-ベンゾフリルメト キシカルボニル基、5-フルオロ-2-ベンゾフリルメトキシカルボニル基、6 ーフルオロー2ーベンゾフリルメトキシカルボニル基、7ーフルオロー2ーベン ゾフリルメトキシカルボニル基、4-クロロ-2-ベンゾフリルメトキシカルボ 25 ニル基、5-クロロ-2-ベンゾフリルメトキシカルボニル基、6-クロロ-2 -ベンゾフリルメトキシカルボニル基、7-クロロ-2-ベンゾフリルメトキシ カルボニル基、4ーブロモー2ーベンゾフリルメトキシカルボニル基、5ーブロ モー2ーベンゾフリルメトキシカルボニル基、6ーブロモー2ーベンゾフリルメ

トキシカルボニル基、7ーブロモー2ーベンゾフリルメトキシカルボニル基、4 - ヨード- 2 - ベンゾフリルメトキシカルボニル基、5 - ヨード-2 - ベンゾフ リルメトキシカルボニル基、6-ヨード-2-ベンゾフリルメトキシカルボニル 基、7-ヨード-2-ベンゾフリルメトキシカルボニル基、4-フルオロ-3-ベンゾフリルメトキシカルボニル基、5-フルオロー3-ベンゾフリルメトキシ カルボニル基、6-フルオロー3-ベンゾフリルメトキシカルボニル基、7-フ ルオロー3ーベンゾフリルメトキシカルボニル基、4ークロロー3ーベンゾフリ ルメトキシカルボニル基、5-クロロー3-ベンゾフリルメトキシカルボニル基、 6-クロロー3-ベンゾフリルメトキシカルボニル基、7-クロロー3-ベンゾ フリルメトキシカルボニル基、4ーブロモー3ーベンゾフリルメトキシカルボニ 10 ル基、5-ブロモー3-ベンゾフリルメトキシカルボニル基、6-ブロモー3-ベンゾフリルメトキシカルボニル基、7-ブロモー3-ベンゾフリルメトキシカ ルボニル基、4-ヨードー3-ベンゾフリルメトキシカルボニル基、5-ヨード - 3 - ベンゾフリルメトキシカルボニル基、6 - ヨード-3 - ベンゾフリルメト キシカルボニル基、7-ヨード-3-ベンゾフリルメトキシカルボニル基、2-15 (4ーフルオロー2ーベンゾフリル) エトキシカルボニル基、2ー(5ーフルオ ロー2-ベンゾフリル)エトキシカルボニル基、2-(6-フルオロー2-ベン ゾフリル) エトキシカルボニル基、2-(7-フルオロ-2-ベンゾフリル) エ トキシカルボニル基、2-(4-クロロ-2-ベンゾフリル) エトキシカルボニ 20 ル基、2-(5-クロロー2-ベンゾフリル)エトキシカルボニル基、2-(6 ークロロー2ーベンゾフリル)エトキシカルボニル基、2-(7-クロロー2-ベンゾフリル)エトキシカルボニル基、2-(4-フルオロ-3-ベンゾフリ ル) エトキシカルボニル基、2-(5-フルオロ-3-ベンゾフリル) エトキシ カルボニル基、2-(6-フルオロ-3-ベンゾフリル)エトキシカルボニル基、 2- (7-フルオロー3-ベンゾフリル) エトキシカルボニル基、2- (4-ク 25ロロー3-ベンゾフリル)エトキシカルボニル基、2-(5-クロロ-3-ベン ゾフリル) エトキシカルボニル基、2-(6-クロロー3-ベンゾフリル) エト キシカルボニル基、2-(7-クロロ-3-ベンゾフリル)エトキシカルボニル 基、6-(4-フルオロー2-ベンゾフリル)へキシルオキシカルボニル基、6

5

10

- (5-フルオロ-2-ベンゾフリル) ヘキシルオキシカルボニル基、6-(6 - フルオロ-2-ベンゾフリル) ヘキシルオキシカルボニル基、6-(7-フルオロ-2-ベンゾフリル) ヘキシルオキシカルボニル基、6-(4-クロロ-2 - ベンゾフリル) ヘキシルオキシカルボニル基、6-(5-クロロ-2-ベンゾフリル) ヘキシルオキシカルボニル基、6-(6-クロロ-2-ベンゾフリル) ヘキシルオキシカルボニル基、6-(7-クロロ-2-ベンゾフリル) ヘキシルオキシカルボニル基、6-(7-クロロ-2-ベンゾフリル) ハキシルボニル基、6-(4-フルオロ-3-ベンゾフリル) ヘキシルオキシカルボニル基、6-(6-フルオロ-3-ベンゾフリル) ヘキシルオキシカルボニル基、6-(4-クロロ-3-ベンゾフリル) ヘキシルオキシカルボニル基、6-(4-クロロ-3-ベンゾフリル) ヘキシルオキシカルボニル基、6-(4-クロロ-3-ベンゾフリル) ヘキシルオキシカルボニル基、6-(5-クロロー

3 ーベンゾフリル) ヘキシルオキシカルボニル基、6 ー(6 ークロロー3 ーベン ゾフリル) ヘキシルオキシカルボニル基、6 ー(7 ークロロー3 ーベンゾフリ ル) ヘキシルオキシカルボニル基、(2,4 ージブロモー3 ーベンゾフリル)メ 15 トキシカルボニル基、(4,5,6 ートリクロロー3 ーベンゾフリル)メトキシ

カルボニル基等のベンゾフラン環上にハロゲン原子が $1\sim3$ 個置換していてもよいベンゾフリル置換 $C1\sim6$ アルコキシカルボニル基を挙げることができる。

ベンゾチエニルC1~6アルコキシカルボニル基(ベンゾチオフェン環上には、 ハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる 20 群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、 2-ベンゾチエニルメトキシカルボニル基、3-ベンゾチエニルメトキシカルボ ニル基、4-ベンゾチエニルメトキシカルボニル基、5-ベンゾチエニルメトキ シカルボニル基、6-ベンゾチエニルメトキシカルボニル基、7-ベンゾチエニ ルメトキシカルボニル基、2-(2-ベンゾチエニル)エトキシカルボニル基、

25 3-(2-ベンゾチエニル)プロポキシカルボニル基、4-(2-ベンゾチエニル)ブトキシカルボニル基、5-(2-ベンゾチエニル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(2-ベンゾチエニル)へキシルオキシカルボニル基、5-トリフルオロメトキシー2-ベンゾチエニルメトキシカルボニル基、5-トリフルオロメトキシー3-ベンゾチエニルメトキシカルボニル基、5-トリフルオロメトキ

シー4ーベンゾチエニルメトキシカルボニル基、4ートリフルオロメトキシー5 ーベンゾチエニルメトキシカルボニル基、3-トリフルオロメトキシー6-ベン ゾチエニルメトキシカルボニル基、2-トリフルオロメトキシ-7-ベンゾチエ ニルメトキシカルボニル基、2-メトキシ-7-ベンゾチエニルメトキシカルボ ニル基、5,6-ジメトキシー3-ベンゾチエニルメトキシカルボニル基、2, 5,6-トリメトキシー3-ベンゾチエニルメトキシカルボニル基、5-クロロ -6-メトキシ-3-ベンゾチエニルメトキシカルボニル基、2-(4-エトキ シー2-ベンゾチエニル)エトキシカルボニル基、5-クロロー3-ベンゾチエ ニルメトキシカルボニル基、3、4-ジブロモ-2-ベンゾチエニルメトキシカ 10 ルボニル基、4,5,6ートリクロロー2ーベンゾチエニルメトキシカルボニル 基、5-トリフルオロメトキシー2-クロロー7-ベンゾチエニルメトキシカル ボニル基等のベンゾチエニルC1~6アルコキシカルボニル基 (ベンゾチオフェ ン環上には、置換基としてハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC1 ~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい)を 15 挙げることができる。

ナフチル置換C1~6アルコキシカルボニル基としては、例えば、1-ナフチルメトキシカルボニル基、2-(1-ナフチル) エトキシカルボニル基、2-(1-ナフチル) エトキシカルボニル基、3-(2-ナフチル) プロポキシカルボニル基、3-(1-ナフチル) プロポキシカルボニル基、3-(2-ナフチル) プロポキシカルボニル基、4-(2-ナフチル) ブトキシカルボニル基、4-(2-ナフチル) ブトキシカルボニル基、5-(1-ナフチル) ペントキシカルボニル基、5-(2-ナフチル) ペントキシカルボニル基、6-(1-ナフチル) ヘキシルオキシカルボニル基、6-(2-ナフチル) ヘキシルオキシカルボニル基、6-(2-ナフチル) ヘキシルオキシカルボニル基等を挙げることができる。

25 ピリジル置換C1~6アルコキシカルボニル基(ピリジン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい)としては、例えば、2ーピリジルメトキシカルボニル基、3ーピリジルメトキシカルボニル基、4ーピリジルメトキシカルボニル基、2-(3-ピリジル)エトキシカルボニル基、2-(3-ピリジル)エトキシカルボニル基、2-(4ーピリジル)エトキシカルボニル基、

3-(2-ピリジル)プロポキシカルボニル基、3-(3-ピリジル)プロポキ シカルボニル基、3-(4-ピリジル)プロポキシカルボニル基、4-(2-ピ リジル)ブトキシカルボニル基、4-(3-ピリジル)ブトキシカルボニル基、 4- (4-ピリジル) ブトキシカルボニル基、5- (2-ピリジル) ペンチルオ キシカルボニル基、5- (3-ピリジル)ペンチルオキシカルボニル基、5-(4-ピリジル) ペンチルオキシカルボニル基、6-(2-ピリジル) ヘキシル オキシカルボニル基、6-(3-ピリジル)へキシルオキシカルボニル基、6-(4-ピリジル) ヘキシルオキシカルボニル基、2-クロロ-3-ピリジルメト キシカルボニル基、3-ブロモー2-ピリジルメトキシカルボニル基、4-フル オロー2ーピリジルメトキシカルボニル基、2-(2-クロロー4-ピリジル) 10 エトキシカルボニル基、2- (3-クロロ-5-ピリジル) エトキシカルボニル 基、2-(4-ヨード-3-ピリジル)エトキシカルボニル基、3-(2-ブロ モー5ーピリジル)プロポキシカルボニル基、3-(3-フルオロー4ーピリジ ル)プロポキシカルボニル基、3-(4-クロロ-2-ピリジル)プロポキシカ 15 ルボニル基、4-(2-ヨード-5-ピリジル)ブトキシカルボニル基、4-(3-ブロモ-5-ピリジル) ブトキシカルボニル基、4-(4-クロロ-5-ピリジル)ブトキシカルボニル基、5- (2-クロロ-5-ピリジル)ペンチル オキシカルボニル基、5-(3-フルオロ-2-ピリジル)ペンチルオキシカル ボニル基、5-(4-ブロモ-2-ピリジル)ペンチルオキシカルボニル基、6 - (2-クロロ-5-ピリジル) ヘキシルオキシカルボニル基、6-(3-フル 20 オロー4ーピリジル) ヘキシルオキシカルボニル基、6ー(4ーブロモー2ーピ リジル) ヘキシルオキシカルボニル基、(2,6-ジクロロー4-ピリジル)メ トキシカルボニル基、(2,3,4-トリクロロ-6-ピリジル)メトキシカル ボニル基等のピリジル置換C1~6アルコキシカルボニル基(ピリジン環上には、 置換基としてハロゲン原子が1~3個置換していてもよい)を挙げることができ 25 る。

フリル置換C1~6アルコキシカルボニル基(フラン環上には、少なくとも1個のニトロ基が置換していてもよい)としては、例えば、2-フリルメトキシカルボニル基、3-フリルメトキシカルボニル基、2-(2-フリル)エトキシカ

ルボニル基、3-(2-フリル)プロポキシカルボニル基、3-(3-フリル) プロポキシカルボニル基、4-(2-フリル)ブトキシカルボニル基、4-(3 -フリル)ブトキシカルボニル基、5-(2-フリル)ペンチルオキシカルボニ ル基、5-(3-フリル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(2-フリル)へ 5 キシルオキシカルボニル基、6-(3-フリル)へキシルオキシカルボニル基。 5-ニトロー2-フリルメトキシカルボニル基、5-ニトロー3-フリルメトキ シカルボニル基、2-(5-ニトロ-2-フリル)エトキシカルボニル基、3-(5-ニトロ-2-フリル) プロポキシカルボニル基、4-(5-ニトロ-2-フリル)ブトキシカルボニル基、4- (5-ニトロ-3-フリル)ブトキシカル ボニル基、5-(5-ニトロ-2-フリル)ペンチルオキシカルボニル基、5-10 (5-ニトロー3-フリル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(5-ニトロー 2-フリル) ヘキシルオキシカルボニル基、6-(5-ニトロ-3-フリル) へ キシルオキシカルボニル基、(4,5-ジニトロ-2-フリル)メトキシカルボ ニル基、(2,4,5-トリニトロー3-フリル)メトキシカルボニル基等のフ 15 リル置換C1~6アルコキシカルボニル基(フラン環上には、置換基としてニト ロ基が1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

チエニル置換C1~6アルコキシカルボニル基(チオフェン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい)としては、例えば、2-チエニルメトキシカルボニル基、3-チエニルメトキシカルボニル基、2-(2-チエ20 ニル)エトキシカルボニル基、3-(2-チエニル)プロポキシカルボニル基、3-(3-チエニル)プロポキシカルボニル基、4-(2-チエニル)ブトキシカルボニル基、4-(2-チエニル)ブトキシカルボニル基、5-(2-チエニル)ペンチルオキシカルボニル基、5-(3-チエニル)ペンチルオキシカルボニル基、5-(3-チエニル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(3-チエニル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(3-チエニル)ペンチルオキシカルボニル基、5-クロロー2-チエニルメトキシカルボニル基、5-クロロー3-チエニル)プロポキシカルボニル基、3-(3-フルオロー2-チエニル)プロポキシカルボニル基、4-(5-ヨード-2-チエニル)ブトキシカルボニル基、4-(4-クロロー3-チエニル)ブトキシカルボニル基、5-(3-クロロー

2-チェニル)ペンチルオキシカルボニル基、5-(2-クロロ-3-チェニル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(3-クロロ-2-チェニル)ペキシルオキシカルボニル基、6-(5-クロロ-3-チェニル)ペキシルオキシカルボニル基、6-(5-クロロ-3-チェニル)ペキシルオキシカルボニル基、(4,5-ジクロロ-2-チェニル)メトキシカルボニル基、(2,4,5-トリクロロ-3-チェニル)メトキシカルボニル基等のチェニル置換C1~6アルコキシカルボニル基(チオフェン環上には、置換基としてハロゲン原子を1~3個有していてまたは、5-ドラス

1~3個有していてもよい)を挙げることができる。 チアゾリル置換 $C1\sim6$ アルコキシカルボニル基(チアゾール環上には、C1~6アルキル基及びフェニル基[フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置 換のC1~6アルキル基が置換していてもよい]からなる群より選ばれた基の少 10 なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、2-チアゾリルメトキ シカルボニル基、2-(2-チアゾリル)エトキシカルボニル基、3-(2-チ アゾリル)プロポキシカルボニル基、4-(2-チアゾリル)ブトキシカルボニ ル基、5-(2-チアゾリル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(2-チアゾ リル) ヘキシルオキシカルボニル基、4-チアゾリルメトキシカルボニル基、5 15 ーチアゾリルメトキシカルボニル基、2-メチル-4-チアゾリルメトキシカル ボニル基、2-メチル-5-チアゾリルメトキシカルボニル基、5-メチル-2 ーチアゾリルメトキシカルボニル基、4-メチル-2-チアゾリルメトキシカル ボニル基、5-メチルー4-チアゾリルメトキシカルボニル基、4-メチル-5 ーチアゾリルメトキシカルボニル基、2-エチル-4-チアゾリルメトキシカル 20 ボニル基、2-エチル-5-チアゾリルメトキシカルボニル基、5-エチル-2 ーチアゾリルメトキシカルボニル基、5-プロピル-2-チアゾリルメトキシカ ルボニル基、4-n-ブチル-2-チアゾリルメトキシカルボニル基、5-エチ ルー4ーチアゾリルメトキシカルボニル基、4-n-ペンチルー5-チアゾリル メトキシカルボニル基、2-n-ヘキシル-4-チアゾリルメトキシカルボニル 25 基、2-n-ヘキシル-5-チアゾリルメトキシカルボニル基、4-n-ペンチ ルー2-チアゾリルメトキシカルボニル基、5-n-ヘキシル-2-チアゾリル メトキシカルボニル基、4-n-ヘキシル-2-チアゾリルメトキシカルボニル 基、5-n-ヘキシル-4-チアゾリルメトキシカルボニル基、4-n-ヘキシ

ルー5-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-フェニルー4-チアゾリルメト キシカルボニル基、2-フェニル-5-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-フェニルー4ーチアゾリルメトキシカルボニル基、4ーフェニルー2ーチアゾリ ルメトキシカルボニル基、5-フェニルー2-チアゾリルメトキシカルボニル基、 2- (4-フェニル-2-チアゾリル) エトキシカルボニル基、5-フェニルー 4-チアゾリルメトキシカルボニル基、4-フェニルー5-チアゾリルメトキシ カルボニル基、5-(2-フルオロフェニル)-2-チアゾリルメトキシカルボ ニル基、5-(2-フルオロフェニル)-4-チアゾリルメトキシカルボニル基、 4-(2-フルオロフェニル)-5-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-(2-ブロモフェニル)-4-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-(2-フ 10 ルオロフェニル) - 5 - チアゾリルメトキシカルボニル基、2 - (3 - クロロフ ェニル) -4-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-(2,3-ジフルオロフ ェニル) -5-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-(2,4-ジブロモフェ ニル) -4-チアゾリルメトキシカルボニル基、4-(2,5-ジクロロフェニ ル) -5-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-(2-クロロフェニル) -4 15 ーチアゾリルメトキシカルボニル基、2-(2,4,6-トリクロロフェニル) - 5 - チアゾリルメトキシカルボニル基、2 - (4 - クロロフェニル) - 4 - チ アゾリルメトキシカルボニル基、2-(2-フルオロフェニル)-5-チアゾリ ルメトキシカルボニル基、2ー(4ークロロフェニル)-5ーチアゾリルメトキ 20 シカルボニル基、2-(2,4-ジクロロフェニル)-5-チアゾリルメトキシ カルボニル基、4-(2-メチルフェニル)-5-チアゾリルメトキシカルボニ ル基、2-(2-エチルフェニル)-4-チアゾリルメトキシカルボニル基、2 - (2-n-プロピルフェニル) - 5-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-(3-イソプロピルフェニル) -4-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-(3-n-ブチルフェニル) -5-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-(4 25 - n -ペンチルフェニル) - 4 - チアゾリルメトキシカルボニル基、4 - (2 n-ヘキシルフェニル)-5-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-(2, 4-ジメチルフェニル)-4-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-(2,3-

ジメチルフェニル) -5-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-(2,4,6

ートリメチルフェニル) -4-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-(2-メ チルフェニル)-4-メチル-5-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-(4 ークロロフェニル) -5-メチル-4-チアゾリルメトキシカルボニル基、2, 4-ジメチル-5-チアゾリルメトキシカルボニル基、5-(2-トリフルオロ メチルフェニル) -2-チアゾリルメトキシカルボニル基、5-(2-トリフル 5 オロメチルフェニル) -4-チアゾリルメトキシカルボニル基、4-(2-トリ フルオロメチルフェニル) -5-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-(2-トリフルオロメチルフェニル) -4-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-(2-トリフルオロメチルフェニル) -5-チアゾリルメトキシカルボニル基、 2-(3-トリフルオロメチルフェニル)-4-チアゾリルメトキシカルボニル 10 基、2-(3-トリフルオロメチルフェニル)-5-チアゾリルメトキシカルボ ニル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)-4-チアゾリルメトキシカ ルボニル基等のチアゾリル置換C1~6アルコキシカルボニル基(チアゾール環 上には、C1~6アルキル基及びフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン置換 もしくは未置換のC1~6アルキル基が1~5個、好ましくは1~3個置換して 15 いてもよい〕からなる群より選ばれた基が1~2個置換していてもよい)を挙げ ることができる。

テトラゾリル置換C1~6アルコキシカルボニル基(テトラゾール環上には、C1~6アルキル基及びフェニル基[フェニル環上には、少なくとも1個のハログン原子が置換していてもよい]からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、5 - (1 H) - テトラゾリルメトキシカルボニル基、2 - (5 - (1 H) - テトラゾリル)エトキシカルボニル基、3 - (5 - (1 H) - テトラゾリル)プロポキシカルボニル基、4 - (5 - (1 H) - テトラゾリル)プトキシカルボニル基、5 - (5 - (1 H) - テトラゾリル)プトキシカルボニル基、5 - (5 - (1 H) - テトラゾリル)へキシルンチルオキシカルボニル基、6 - (5 - (1 H) - テトラゾリル)へキシルオキシカルボニル基、1 - メチル-5 - (1 H) - テトラブリルメトキシカルボニル基、1 - エチル-5 - (1 H) - テトラブリルメトキシカルボニル基、1 - エチル-5 - (1 H) - テトラブリルメトキシカルボニル基、1 - ロープロピル-5 - (1 H) - テトラブリルメトキシカルボニル基、1 - ロープロピル-5 - (1 H) - テトラブリルメトキシカルボニル基、1 - ローペンチル

-5-(1H) -テトラゾリルメトキシカルボニル基、1-n-ヘキシル-5-(1H) -テトラゾリルメトキシカルボニル基、1-フェニル-5-(1H)-テトラゾリルメトキシカルボニル基、1-(2-フルオロフェニル)-5-(1 H) ーテトラゾリルメトキシカルボニル基、1-(3-フルオロフェニル)-5 5 - (1H) - テトラゾリルメトキシカルボニル基、1- (4-フルオロフェニ ル) -5-(1H) -テトラゾリルメトキシカルボニル基、1-(2-クロロフ ェニル) -5-(1H) -テトラゾリルメトキシカルボニル基、1-(3-クロ ロフェニル) -5-(1H) -テトラゾリルメトキシカルボニル基、1-(4-クロロフェニル) -5-(1H) -テトラゾリルメトキシカルボニル基、1-(2-ブロモフェニル)-5-(1H)-テトラゾリルメトキシカルボニル基、 10 1-(3-ブロモフェニル)-5-(1H)-テトラゾリルメトキシカルボニル 基、1-(4-ブロモフェニル)-5-(1H)-テトラブリルメトキシカルボ ニル基、2-(1-メチル-5-(1H)-テトラブリル)エトキシカルボニル 基、2-(1-エチル-5-(1H)ーテトラゾリル)エトキシカルボニル基、 2-(1-)プロピルー5-(1H) ーテトラゾリル) エトキシカルボニル基、215 (1-ブチル-5-(1H)ーテトラゾリル)エトキシカルボニル基、2-(1ーペンチル-5-(1H)ーテトラブリル)エトキシカルボニル基、2-(1-ヘキシル-5-(1H)ーテトラゾリル)エトキシカルボニル基、2-(1-フェニル-5-(1H)ーテトラゾリル)エトキシカルボニル基、2-(1-(2, 4-ジフルオロフェニル)-5-(1H)-テトラゾリル)エトキ 20 シカルボニル基、2-(1-(3-フルオロフェニル)-5-(1H)-テトラ ゾリル) エトキシカルボニル基、2-(1-(4-フルオロフェニル)-5-(1H) ーテトラゾリル) エトキシカルボニル基、2-(1-(2, 4, 6-)リクロロフェニル)-5-(1H)-テトラゾリル)エトキシカルボニル基、2 - (1-(3-クロロフェニル)-5-(1H)-テトラゾリル)エトキシカル 25 ボニル基、2-(1-(4-クロロフェニル)-5-(1H)ーテトラゾリル) エトキシカルボニル基、2-(1-(2-ブロモフェニル)-5-(1H)-テ トラゾリル) エトキシカルボニル基、2-(1-(3-ブロモフェニル) -5-

(1H) -テトラゾリル) エトキシカルボニル基、2-(1-(4-ブロモフェ

5

25

ニル)-5-(1H)-テトラゾリル)エトキシカルボニル基等のテトラゾリル 置換C1~6アルコキシカルボニル基(テトラゾール環上には、置換基としてC 1~6アルキル基及びフェニル基 [フェニル環上には、1~5個、好ましくは1 ~3個のハロゲン原子が置換していてもよい]からなる群より選ばれた基が1~ 3個置換していてもよい)を挙げることができる。

2,3-ジヒドロー1H-インデニルオキシカルボニル基としては、例えば、2,3-ジヒドロー1H-インデンー1-イルオキシカルボニル基、2,3-ジヒドロー1H-インデンー2ーイルオキシカルボニル基等を挙げることができる。アダマンタン置換C1~6アルコキシカルボニル基としては、例えば、アダマンタンー1ーイルメトキシカルボニル基、2-(アダマンタンー1ーイル)エトキシカルボニル基、3-(アダマンタンー1ーイル)プロポキシカルボニル基、4-(アダマンタンー1ーイル)ブトキシカルボニル基、5-(アダマンタンー1ーイル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(アダマンタンー1ーイル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(アダマンタンー1ーイル)ペキシカルボニル基等が挙げられる。

15 フェニルC3~6アルキニルオキシカルボニル基としては、例えば、2-フェニルエチニルオキシカルボニル基、3-フェニル-2-プロピニルオキシカルボニル基、4-フェニル-3-ブチン-1-イルオキシカルボニル基、4-フェニル-3-ブチン-2-イルオキシカルボニル基、5-フェニル-4-ペンチン-1-イルオキシカルボニル基、6-フェニル-5-ヘキシン-1-イルオキシカルボニル基等を挙げることができる。

フェニルチオC1~6アルコキシカルボニル基としては、例えば、フェニルチオメトキシカルボニル基、2-フェニルチオエトキシカルボニル基、1-フェニルチオエトキシカルボニル基、3-(フェニルチオ)プロポキシカルボニル基、4-(フェニルチオ)ブトキシカルボニル基、5-(フェニルチオ)ペンチルオキシカルボニル基、6-(フェニルチオ)ヘキシルオキシカルボニル基等を挙げることができる。

フェニルC1~6アルコキシ置換C1~6アルコキシカルボニル基としては、 例えば、ベンジルオキシメトキシカルボニル基、2 ーベンジルオキシエトキシカ ルボニル基、3 - (ベンジルオキシ)プロポキシカルボニル基、4 - (ベンジル

オキシ)ブトキシカルボニル基、5-(ベンジルオキシ)ペンチルオキシカルボ ニル基、6-(ベンジルオキシ)へキシルオキシカルボニル基、2-フェニルエ トキシメトキシカルボニル基、2-フェニルエトキシエトキシカルボニル基、3 - (2-フェニルエトキシ) プロポキシカルボニル基、4-(2-フェニルエト キシ)ブトキシカルボニル基、5-(2-フェニルエトキシ)ペンチルオキシカ ルボニル基、6-(2-フェニルエトキシ) ヘキシルオキシカルボニル基、3-フェニルプロポキシメトキシカルボニル基、3-フェニルプロポキシエトキシカ ルボニル基、3-(3-フェニルプロポキシ)プロポキシカルボニル基、4-(3-フェニルプロポキシ) ブトキシカルボニル基、5-(3-フェニルプロポ キシ)ペンチルオキシカルボニル基、6-(3-フェニルプロポキシ)ヘキシル 10 オキシカルボニル基、4-フェニルブトキシメトキシカルボニル基、4-フェニ ルブトキシエトキシカルボニル基、3-(4-フェニルブトキシ)プロポキシカ ルボニル基、4-(4-フェニルブトキシ)ブトキシカルボニル基、5-(4-フェニルブトキシ) ペンチルオキシカルボニル基、6-(4-フェニルブトキ シ) ヘキシルオキシカルボニル基、5-フェニルペンチルオキシメトキシカルボ 15 ニル基、5-フェニルペンチルオキシエトキシカルボニル基、3-(5-フェニ ルペンチルオキシ)プロポキシカルボニル基、4-(5-フェニルペンチルオキ シ)ブトキシカルボニル基、5-(5-フェニルペンチルオキシ) ペンチルオキ シカルボニル基、6-(5-フェニルペンチルオキシ) ヘキシルオキシカルボニ 20 ル基、6-フェニルヘキシルオキシメトキシカルボニル基、6-フェニルヘキシ ルオキシエトキシカルボニル基、3-(6-フェニルヘキシルオキシ)プロポキ シカルボニル基、4-(6-フェニルヘキシルオキシ)ブトキシカルボニル基、 5-(6-フェニルヘキシルオキシ)ペンチルオキシカルボニル基、6-(6-フェニルヘキシルオキシ)ヘキシルオキシカルボニル基等を挙げることができる。 C2~6アルケニルオキシカルボニル基としては、例えば、ビニルオキシカル 25 ボニル基、2-プロペニルオキシカルボニル基(慣用名:アリルオキシカルボニ ル基)、2-ブテン-1-イルオキシカルボニル基、3-ブテン-1-イルオキ シカルボニル基、4-ペンテン-1-イルオキシカルボニル基、3-ペンテン-

1-イルオキシカルボニル基、5-ヘキセン-1-イルオキシカルボニル基、4

- ヘキセン- 1 - イルオキシカルボニル基、3 - ヘキセン- 1 - イルオキシカルボニル基等を挙げることができる。

C2~6アルキニルオキシカルボニル基としては、例えば、アセチレンオキシカルボニル基、2-プロピニルオキシカルボニル基、2-ブチン-1-イルオキシカルボニル基、3-ブチン-1-イルオキシカルボニル基、4-ペンチン-1-イルオキシカルボニル基、5-ヘキシン-1-イルオキシカルボニル基、4-ヘキシン-1-イルオキシカルボニル基、1-ル基、3-ヘキシン-1-イルオキシカルボニル基、5-ル基、3-ヘキシン-1-イルオキシカルボニル基等を挙げることができる。

C3~8シクロアルキル置換C1~6アルコキシカルボニル基としては、例え ば、シクロプロピルメトキシカルボニル基、シクロブチルメトキシカルボニル基、 10 シクロペンチルメトキシカルボニル基、シクロヘキシルメトキシカルボニル基、 シクロヘプチルメトキシカルボニル基、シクロオクチルメトキシカルボニル基、 2-シクロプロピルエトキシカルボニル基、2-シクロブチルエトキシカルボニ ル基、2ーシクロペンチルエトキシカルボニル基、2-シクロヘキシルエトキシ カルボニル基、2-シクロヘプチルエトキシカルボニル基、3-シクロプロピル 15 プロポキシカルボニル基、3ーシクロブチルプロポキシカルボニル基、3ーシク ロペンチルプロポキシカルボニル基、3-シクロヘキシルプロポキシカルボニル 基、3-シクロヘプチルプロポキシカルボニル基、3-シクロオクチルプロポキ シカルボニル基、4-シクロプロピルブトキシカルボニル基、4-シクロブチル ブトキシカルボニル基、4-シクロヘキシルブトキシカルボニル基、5-シクロ 20 ヘキシルペンチルオキシカルボニル基、6-シクロヘキシルヘキシルオキシカル ボニル基等を挙げることができる。

ベンゾイル置換C1~6アルコキシカルボニル基としては、例えば、ベンゾイルメトキシカルボニル基、2ーベンゾイルエトキシカルボニル基、1ーベンゾイ 25 ルエトキシカルボニル基、3ー(ベンゾイル)プロポキシカルボニル基、4ー(ベンゾイル)ブトキシカルボニル基、5ー(ベンゾイル)ペンチルオキシカルボニル基、6ー(ベンゾイル)ヘキシルオキシカルボニル基等を挙げることができる。

フェノキシ基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置

換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。)としては、例えば、フェノキシ基、2-フルオロフェノキシ基、3-フルオロフェノキシ基、4-フルオロフェノキシ基、2-クロロフェノキシ基、3-グロモフェノキシ基、4-グロロフェノキシ基、2-ブロモフェノキシ基、3-ブロモフェノキシ基、4-ブロモフェノキシ基、2-ヨードフェノキシ基、3-ヨードフェノキシ基、

4ーブロモフェノキシ基、2ーヨードフェノキシ基、3ーヨードフェノキシ基、4ーヨードフェノキシ基、2,3ージフルオロフェノキシ基、3,4ージフルオロフェノキシ基、3,4ージフルオロフェノキシ基、2,4ージフルオロフェノキシ基、2,6ージフルオロフェノキシ基、2,3ージクロロフェノキシ基、3,

10 4-ジクロロフェノキシ基、3,5-ジクロロフェノキシ基、2,4-ジクロロフェノキシ基、2,6-ジクロロフェノキシ基、2,3,4-トリフルオロフェノキシ基、3,4,5-トリクロロフェノキシ基、3,4,5-トリクロロフェノキシ基、2,4,6-トリフルオロフェノキシ基、2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェノキシ基、2,4,6-トリクロロフェノキシ基、2-フルオ

15 ロー4ークロロフェノキシ基、2ーフルオロー4ーブロモフェノキシ基、3ーフルオロー4ークロロフェノキシ基、2ーメチルフェノキシ基、3ーメチルフェノキシ基、4ーメチルフェノキシ基、2,6ージメチルフェノキシ基、2,4,6ートリメチルフェノキシ基、2ーメチルー3ークロロフェノキシ基、3ーメチルー4ークロロフェノキシ基、2ーメチル

20 -3-フルオロフェノキシ基、2-トリフルオロメチルフェノキシ基、3-トリフルオロメチルフェノキシ基、4-トリフルオロメチルフェノキシ基、3,5-ジ(トリフルオロメチル)フェノキシ基、3,4-ジ(トリフルオロメチル)フェノキシ基、2,4-ジ(トリフルオロメチル)フェノキシ基、2-ペンタフルオロエチルフェノキシ基、3-ペンタフルオロエチルフェノキシ基、4-ペンタ

25 フルオロエチルフェノキシ基、2ーイソプロピルフェノキシ基、3ーイソプロピルフェノキシ基、3ーイソプロピルフェノキシ基、3ーイソプロピルフェノキシ基、2ーtertーブチルフェノキシ基、3ーtertーブチルフェノキシ基、4ーtertーブチルフェノキシ基、2ーsecーブチルフェノキシ基、3ーsecーブチルフェノキシ基、4ーsecーブチルフェノキシ基、4ーnープチルフェノキシ基、4ーnーペンチル

、フェノキシ基、4-n-ヘキシルフェノキシ基、2-n-ヘプタフルオロプロピ ルフェノキシ基、3-n-ヘプタフルオロプロピルフェノキシ基、4-n-ヘプ タフルオロプロピルフェノキシ基、4-ペンチルフェノキシ基、4-ヘキシルフ ェノキシ基、2-メトキシフェノキシ基、3-メトキシフェノキシ基、4-メト キシフェノキシ基、2-メトキシー3-クロロフェノキシ基、2-フルオロー3 -メトキシフェノキシ基、2-フルオロ-4-メトキシフェノキシ基、2-フル オロー4ーブロモフェノキシ基、4ークロロー3ーフルオロフェノキシ基、2, 3, 4-トリクロロフェノキシ基、3, 4, 5-トリフルオロフェノキシ基、2, 4,6-トリクロロフェノキシ基、2,4-ジメチルフェノキシ基、2,3-ジ メチルフェノキシ基、3,5-ジメチルフェノキシ基、2,5-ジメチルフェノ 10 キシ基、4-イソプロポキシフェノキシ基、4-n-ブトキシフェノキシ基、2, 4-ジメトキシフェノキシ基、2,3-ジメトキシフェノキシ基、3,5-ジメ トキシフェノキシ基、2,5-ジメトキシフェノキシ基、2,4,6-トリメト キシフェノキシ基、3,5-ジ(トリフルオロメトキシ)フェノキシ基、3-ク ロロー4ーメトキシフェノキシ基、2ークロロー4ートリフルオロメトキシフェ 15 ノキシ基、3ーメチルー4ーフルオロフェノキシ基、4ーブロモー3ートリフル オロメチルフェノキシ基、2,6-ジメトキシフェノキシ基、2-トリフルオロ メトキシフェノキシ基、3ートリフルオロメトキシフェノキシ基、4ートリフル オロメトキシフェノキシ基、2,3-ジ(トリフルオロメトキシ)フェノキシ基、 2, 4-ジ (トリフルオロメトキシ) フェノキシ基、2-ペンタフルオロエトキ 20 シフェノキシ基、3-ペンタフルオロエトキシフェノキシ基、4-ペンタフルオ ロエトキシフェノキシ基、2-イソプロポキシフェノキシ基、3-イソプロポキ シフェノキシ基、4ーイソプロポキシフェノキシ基、2-tertーブトキシフ ェノキシ基、3-tert-ブトキシフェノキシ基、4-tert-ブトキシフ ェノキシ基、2-sec-ブトキシフェノキシ基、3-sec-ブトキシフェノ 25 キシ基、4-sec-ブトキシフェノキシ基、4-n-ヘキシルオキシフェノキ シ基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェノキシ基、3-n-ヘプタフルオ ロプロポキシフェノキシ基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェノキシ基基 等のフェノキシ基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未 置換 $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基が $1\sim5$ 個、好ましくは $1\sim3$ 個置換していてもよい。)

8-アザビシクロ[3, 2, 1] オクチル基(8-アザビシクロ[3, 2,

- 5 1] オクタン環上には、少なくとも1個のフェノキシ基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。)が置換していてもよい。)としては、例えば、8-アザビシクロ[3, 2, 1] オクタン-8-イル基、3-フェノキシ-8-ア
 10 ザビシクロ[3, 2, 1] オクタン-8-イル基、3-(3-クロロフェノキシ)-8-アザビシクロ[3, 2, 1] オクタン-1-イル基、3-(4-ブロモフェノキシ)-8-アザビシクロ[3, 2, 1] オクタン-8-イル基、3-(2-フルオロフェノキシ)-8-アザビシクロ[3, 2, 1] オクタン-8-イル基、3-
- 15 タン-8-イル基、3-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)-8-アザビシクロ[3, 2, 1] オクタン-1-イル基、3-(3-メチルフェノキシ)-8-アザビシクロ[3, 2, 1] オクタン-1-イル基、3-(4-メトキシフェノキシ)-8-アザビシクロ[3, 2, 1] オクタン-1-イル基、3-(3, 5-ジトリフルオロメチルフェノキシ)-8-アザビシクロ[3, 2, 1] オクタン-1

イル基、3-(3-ヨードフェノキシ)-8-アザビシクロ[3,2,1]オク

- タン-1-イル基、3-(3-トリフルオロメチル-4-フルオロフェノキシ) -8-アザビシクロ[3, 2, 1] オクタン-1-イル基、3-(2-トリフル オロメトキシー3-クロロフェノキシ) -8-アザビシクロ[3, 2, 1] オクタン-1-イル基、3-(2, 4-ジフルオロフェノキシ) -8-アザビシクロ[3, 2, 1] オクタン-1-イル基、3-(2, 4, 6-トリクロロフェノキ
- 25 シ) -8-アザビシクロ[3, 2, 1] オクタン-1-イル基、3-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) -8-アザビシクロ[3, 2, 1] オクタン-1-イル基、3-(3-トルフルオロメトキシフェノキシ) -8-アザビシクロ[3, 2, 1] オクタン-1-イル基、3-(4-トルフルオロメトキシフェノキシ) -8-アザビシクロ[3, 2, 1] オクタン-1-イル基等の8-アザビシクロ

[3, 2, 1] オクチル基(8-アザビシクロ[3, 2, 1] オクタン環上には、 置換基としてフェノキシ基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換も しくは未置換 $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換 $OC1\sim6$ ア ルコキシ基からなる群より選ばれた基が $1\sim5$ 個、好ましくは $1\sim3$ 個置換して いてもよい。)を少なくとも1種が置換していてもよい。)を挙げることができ る。

ピリジル基[ピリジン環上には、置換基としてハロゲン置換もしくは未置換C 1~6アルキル基を少なくとも1個が置換していてもよい]としては、例えば、 ピリジン-3-イル基、ピリジン-2-イル基、ピリジン-4-イル基、4-ト リフルオロメチルピリジンー2-イル基、4-トリフルオロメチルピリジン-3 10 ーイル基、5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル基、5-トリフルオロメ チルピリジン-3-イル基、2-トリフルオロメチルピリジン-3-イル基、2, 4-ジメチルピリジン-3-イル基、3,4,5-トリメチルピリジン-2-イ ル基、4-エチルピリジン-2-イル基、3-n-ブチルピリジン-2-イル基、 5-n-ペンチルピリジン-2-イル基、4-n-ヘキシルピリジン-2-イル 15 基等のピリジル基(ピリジン環上には、置換基としてハロゲン置換もしくは未置 換C1~6アルキル基が1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。 R⁴⁷及びR⁴⁸が隣接する窒素原子と共に、他のヘテロ原子を介し又は介す ることなく互いに結合して形成する5~7員環の飽和複素環(該複素環上には、 置換基として少なくとも1個のフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、 20 ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置 換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換し ていてもよい]が置換していてもよい。)としては、例えば、ピロリジニル基、 モルホリノ基、チオモルホリノ基、ピペラジル基、ピペリジル基、ホモピペラジ ル基、4-フェニルピペラジン-1-イル基、4-フェニルピペリジン-1-イ 25

ル基、4-フェニルピペラジン-1-イル基、4-フェニルピペリジン-1-イル基、4-(3-クロロフェニル) ピペラジン-1-イル基、4-(4-クロロフェニル) ピペラジン-1-イル基、4-(4-クロロフェニル) ピペラジン-1-イル基、4-(3-トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン-1-イル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン-1-イル基、4

- (3-トリフルオロメトキシフェニル)ピペラジン-1-イル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン-1-イル基、4-フェニルピペリ ジン-1-イル基、4-(3-クロロフェニル)ピペリジン-1-イル基、4-(4-クロロフェニル) ピペリジン-1-イル基、4-(3,4-ジクロロフェ ニル)ピペリジン-1-イル基、4-(3-トリフルオロメチルフェニル)ピペ リジンー1ーイル基、4ー(4ートリフルオロメチルフェニル)ピペリジンー1 ーイル基、4-(3-トリフルオロメトキシフェニル)ピペリジン-1-イル基、 4-(4-1)フルオロメトキシフェニル) ピペリジンー1-1ル基、4-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピペラジン-1-イル基、4-(4-メチルフ ェニル)ピペラジン-1-イル基、4-(3-メトキシフェニル)ピペラジン-10 1-イル基、4-(3,4-ジメトキシロフェニル)ピペラジン-1-イル基、 4-(2, 4-ジメチルフェニル) ピペラジン-1-イル基、4-(2, 4, 6 ートリメトキシフェニル) ピペラジン-1-イル基、4-(3,4,5-トリメ チルフェニル) ピペラジンー1ーイル基、4-(2,4,6-トリフルオロフェ ニル) ピペリジンー1ーイル基、4ー(2、3、4、5、6ーペンタフルオロフ 15 ェニル) ピペリジン-1-イル基、4-(4-メチルフェニル) ピペリジン-1 ーイル基、4-(3-メトキシフェニル)ピペリジン-1-イル基、4-(3, 4-ジメトキシロフェニル)ピペリジン-1-イル基、4-(2,4-ジメチル フェニル)ピペリジン-1-イル基、4-(2,4,6-トリメトキシフェニ ル)ピペリジン-1-イル基、4-(3,4,5-トリメチルフェニル)ピペリ 20 ジン-1-イル基、3-(4-メチルフェニル) モルホリノ基、3-(3-メト キシフェニル) ピロリジニルー1ーイル基、2-(4-メチルフェニル) ピロリ ジニルー1ーイル基、4ー(2、4、6ートリメトキシフェニル)ホモピペラジ ンー1ーイル基、4ー(3,4,5ートリメチルフェニル)チオモルホリノ基、 2.4-ジフェニルピペラジン-1-イル基、2,4,6-トリフェニルピペラ 25 ジンー1ーイル基、4ーフェニルピペラジンー1ーイル基、4ーフェニルピペリ ジン-1-イル基、3-(3-クロロフェニル)ピロリジン-1-イル基、3-(4-クロロフェニル) モルホリノ基、4-(3,4-ジクロロフェニル) ホモ ピペラジン-1-イル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル) チオモルホ

リノ基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピロリジン-1-イル基、2
-(3-トリフルオロメトキシフェニル)モルホリノ基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ホモピペラジン-1-イル基、3-フェニルピロリジン-1-イル基、4-(3-クロロフェニル)モルホリノ基、4-(4-クロロフェニル)ホモピペリジン-1-イル基、3-(3,4-ジクロロフェニル)チオモルホリノ基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)ピロリジン-1-イル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ホモピペラジン-1-イル基、3-フェニルチオモルホリノ基、4-フェニルモルホリノ基等の複素環上に置換基としてフェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換してフェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換してフェニル基の分別である。

アミノ置換C2~6アルケニル基(該アミノ基には、C1~6アルキル基及び フェニル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 15 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基から なる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]からなる群より 選ばれる基を少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、アミノ ビニル基、3-アミノ-2-プロペニル基、3-アミノ-1-プロペニル基、4 ーアミノー3ーブテニル基、4ーアミノー3ーブテニル基、5ーアミノー4ーペ 20 ンテニル基、6-アミノー5-ヘキセニル基、メチルアミノビニル基、3-メチ ルアミノー2ープロペニル基、3ーメチルアミノー1ープロペニル基、4ーメチ ルアミノー3ーブテニル基、4ーメチルアミノー3ーブテニル基、5ーメチルア ミノー4ーペンテニル基、6ーメチルアミノー5ーへキセニル基、メチルアミノ ビニル基、3-メチルアミノ-2-プロペニル基、3-ジメチルアミノ-2-プ ロペニル基、3-エチルアミノ-1-プロペニル基、3-ジエチルアミノ-1-25 プロペニル基、4-エチルアミノ-3-ブテニル基、4-ジメチルアミノ-3-ブテニル基、4-ジエチルアミノ-3-ブテニル基、5-エチルアミノ-4-ペ ンテニル基、6-エチルアミノ-5-ヘキセニル基、n-プロピルアミノビニル 基、3-n-プロピルアミノ-2-プロペニル基、3-n-プロピルアミノ-1

ープロペニル基、4-n-プロピルアミノー3-ブテニル基、4-n-プロピル アミノー 3 ーブテニル基、 5 ー n ープロピルアミノー 4 ーペンテニル基、 6 ー n ープロピルアミノー5-ヘキセニル基、n-ブチルアミノビニル基、3-n-ブ チルアミノー2ープロペニル基、3-n-ブチルアミノー1-プロペニル基、4 - nーブチルアミノー3ーブテニル基、4-nーブチルアミノー3ーブテニル基、 5-n-ブチルアミノ-4-ペンテニル基、6-n-ブチルアミノ-5-ヘキセ ニル基、nーペンチルアミノビニル基、3-n-ペンチルアミノ-2-プロペニ ル基、3-n-ヘキシルアミノ-1-プロペニル基、4-n-ヘキシルアミノ-3ーブテニル基、4-n-ヘキシルアミノー3ーブテニル基、5-n-ヘキシル アミノー4ーペンテニル基、6-nーペンチルアミノー5ーヘキセニル基、フェ 10 ニルアミノビニル基、3-フェニルアミノ-2-プロペニル基、3-フェニルア ミノー1ープロペニル基、4ーフェニルアミノー3ーブテニル基、4ーフェニル アミノー3ーブテニル基、5ーフェニルアミノー4ーペンテニル基、6ーフェニ ルアミノー5-ヘキセニル基、4-クロロフェニルアミノビニル基、3-(4-15 ブロモフェニル)アミノー2ープロペニル基、3-(2,4-ジクロロフェニ ル) アミノー1ープロペニル基、4-(2,4,6-トリクロロフェニル) アミ $J-3-\overline{J}$ テニル基、4-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル) アミノー3ーブテニル基、4ー(4ーフルオロフェニル)アミノー3ーブテニル基、 5-(4-ヨードフェニル)アミノー4ーペンテニル基、6-(4-クロロフェ ニル)アミノー5ーヘキセニル基、(3ーメチルフェニル)アミノビニル基、 20 (4ートリフルオロメチルフェニル)アミノビニル基、3-(4ートリフルオロ メチルフェニル)アミノー2ープロペニル基、3-(4-トリフルオロメチルフ ェニル)アミノー1ープロペニル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル) アミノー3-ブテニル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)アミノ-3 - 一ブテニル基、5- (3,4ージメチルフェニル)アミノ-4-ペンテニル基、 25 6-(3,4,5-トリメチルフェニル)アミノ-5-ヘキセニル基、(2-メ トキシフェニル) アミノビニル基、(4 – トリフルオロメトキシフェニル) アミ ノビニル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)アミノー2-プロペニ ル基、3-(3,5-ジメトキシフェニル)アミノ-1-プロペニル基、410

(2,5-i)メトキシフェニル)アミノー3-iブテニル基、4-(2,4,6-i)トリメトキシフェニル)アミノー3-iブテニル基、5-[N-i)ルーNー(4-iトリフルオロメチルフェニル)アミノ]-4-iペンテニル基、6-[N-i]ルーNー(4-iリフルオロメトキシフェニル)アミノ]-5-iルーNー(4-iリフルオロメトキシフェニル)アミノ]-5-iルー基ののアミノ置換C2~6アルケニル基(該アミノ基には、C1~6アルキル基及びフェニル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい。]からなる群より選ばれる基が1~20個置換していてもよい。)を挙げることができる。

オキサゾリジニル基(オキサゾリジン環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい。)としては、例えば、オキサゾリジン-4-イル基、オキサゾリジン-5-イル基、2-オキソオキサゾリジン-4-イル基、2-オキソーオキサゾリジン-5-イル基等を挙げることができる。

フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、フェノキシ基[フェニル環 15 上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハ ロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の 少なくとも1種が置換していてもよい];ハロゲン原子;ハロゲン置換もしくは 未置換のC1~6アルキル基;ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキ シ基;アミノ基(アミノ基上には、C1~6アルキル基及びフェニルC1~6ア 20 ルキル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換С1 ~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からな る群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)からなる群より選 ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);ピペラジニル基[ピペラジ ン環上には、少なくとも1個のフェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、 25 ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置 換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくと も1種が置換していてもよい)が置換していてもよい]及びピペリジル基[ピペ リジン環上には、少なくとも1個のアミノ基が置換していてもよい。該アミノ基

上には、フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは 未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキ シ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)及びC 1~6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していても 5 よい。]なる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)として は、例えば、ベンジル基、1-フェネチル基、2-フェネチル基、3-フェニル プロピル基、2-フェニルプロピル基、4-フェニルブチル基、5-フェニルペ ンチル基、4-フェニルペンチル基、6-フェニルヘキシル基、2-フルオロベ ンジル基、3-フルオロベンジル基、4-フルオロベンジル基、2-クロロベン ジル基、3-クロロベンジル基、4-クロロベンジル基、2-ブロモベンジル基、 3-ブロモベンジル基、4-ブロモベンジル基、2-ヨードベンジル基、3-ヨ ードベンジル基、4-ヨードベンジル基、2,3-ジフルオロベンジル基、3, 4-ジフルオロベンジル基、3,5-ジフルオロベンジル基、2,3,4,5, 6-ペンタフルオロベンジル基、2,4-ジフルオロベンジル基、2,6-ジフ 15 ルオロベンジル基、2,3-ジクロロベンジル基、3,4-ジクロロベンジル基、 3,5-ジクロロベンジル基、2,4-ジクロロベンジル基、2,6-ジクロロ ベンジル基、2-フルオロー4-ブロモベンジル基、4-クロロー3-フルオロ ベンジル基、2,3,4-トリクロロベンジル基、3,4,5-トリフルオロベ ンジル基、2,4,6-トリクロロベンジル基、4-イソプロピルベンジル基、 4-n-ブチルベンジル基、4-メチルベンジル基、2-メチルベンジル基、3 20 ーメチルベンジル基、2,4ージメチルベンジル基、2,3ージメチルベンジル 基、2,6-ジメチルベンジル基、3,5-ジメチルベンジル基、2,5-ジメ チルベンジル基、2,4,6-トリメチルベンジル基、3,5-ジトリフルオロ メチルベンジル基、2,3,4,5,6-ペンタフルオロベンジル基、4-イソ プロポキシベンジル基、4-n-ブトキシベンジル基、4-メトキシベンジル基、 2-メトキシベンジル基、3-メトキシベンジル基、2, 4-ジメトキシベンジ ル基、2、3-ジメトキシベンジル基、2,6-ジメトキシベンジル基、3,5 ージメトキシベンジル基、2、5ージメトキシベンジル基、2、4、6ートリメ

トキシベンジル基、3,5-ジトリフルオロメトキシベンジル基、2-イソプロ

ポキシベンジル基、3-クロロー4-メトキシベンジル基、2-クロロー4-ト リフルオロメトキシベンジル基、3-メチルー4-フルオロベンジル基、4-ブ ロモー3ートリフルオロメチルベンジル基、2ートリフルオロメチルベンジル基、 3-トリフルオロメチルベンジル基、4-トリフルオロメチルベンジル基、2-5 ペンタフルオロエチルベンジル基、3-ペンタフルオロエチルベンジル基、4-ペンタフルオロエチルベンジル基、2-トリフルオロメトキシベンジル基、3-トリフルオロメトキシベンジル基、4-トリフルオロメトキシベンジル基、2-ペンタフルオロエトキシベンジル基、3-ペンタフルオロエトキシベンジル基、 4-ペンタフルオロエトキシベンジル基、2-(2-トリフルオロメチルフェニ ル) エチル基、2- (3-トリフルオロメチルフェニル) エチル基、2- (4-10 トリフルオロメチルフェニル) エチル基、2-(2-トリフルオロメトキシフェ ニル) エチル基、2-(3-トリフルオロメトキシフェニル) エチル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニル) エチル基、2-(2-ペンタフルオロエ トキシフェニル) エチル基、2-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル) エチ ル基、2-(4-ペンタフルオロエトキシフェニル) エチル基、3-(2-トリ 15 フルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニ ル)プロピル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(2-トリフルオロメトキシフェニル)プロピル基、3-(3-トリフルオロメ トキシフェニル)プロピル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)プロ ピル基、3-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)プロピル基、3-(4-20 ペンタフルオロエトキシフェニル)プロピル基、4-(3-ペンタフルオロエト キシフェニル)ブチル基、5-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチル基、 4- (4-トリフルオロメチルフェニル) ペンチル基、4- (4-トリフルオロ メトキシフェニル)ペンチル基、6-(3-トリフルオロメチルフェニル)へキ シル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル)へキシル基、6-(4-トリ 25 フルオロメトキシフェニル) ヘキシル基、2-アミノベンジル基、2, 4-ジア ミノベンジル基、2、4、6-トリアミノベンジル基、2-メチルアミノベンジ ル基、2-ベンジルアミノベンジル基、2-フルオロベンジルアミノベンジル基、 3-フルオロベンジルアミノベンジル基、4-フルオロベンジルアミノベンジル

基、2-クロロベンジル基、3-クロロベンジルアミノベンジル基、4-クロロ ベンジルアミノベンジル基、2-ブロモベンジルアミノベンジル基、3-ブロモ ベンジルアミノベンジル基、4ーブロモベンジルアミノベンジル基、2-ヨード ベンジルアミノベンジル基、3-ヨードベンジルアミノベンジル基、4-ヨード 5 ベンジルアミノベンジル基、2,3-ジフルオロベンジルアミノベンジル基、3, 4-ジフルオロベンジルアミノベンジル基、3,5-ジフルオロベンジルアミノ ベンジル基、2,3,4,5,6-ペンタフルオロベンジルアミノベンジル基、 2, 4-ジフルオロベンジルアミノベンジル基、2, 6-ジフルオロベンジルア ミノベンジル基、2,3ージクロロベンジルアミノベンジル基、3,4-ジクロ ロベンジルアミノベンジル基、3,5-ジクロロベンジルアミノベンジル基、2, 10 4-ジクロロベンジルアミノベンジル基、2,6-ジクロロベンジルアミノベン ジル基、2-フルオロー4-ブロモベンジルアミノベンジル基、4-クロロ-3 ーフルオロベンジルアミノベンジル基、2,3,4ートリクロロベンジルアミノ ベンジル基、3,4,5ートリフルオロベンジルアミノベンジル基、2,4,6 15 - トリクロロベンジルアミノベンジル基、4-イソプロピルベンジルアミノベン ジル基、4-n-ブチルベンジルアミノベンジル基、4-メチルベンジルアミノ ベンジル基、2-メチルベンジルアミノベンジル基、3-メチルベンジルアミノ ベンジル基、2, 4-ジメチルベンジルアミノベンジル基、2, 3-ジメチルベ ンジルアミノベンジル基、2,6-ジメチルベンジルアミノベンジル基、3,5 20 - ジメチルベンジルアミノベンジル基、2,5-ジメチルベンジルアミノベンジ ル基、2、4、6-トリメチルベンジルアミノベンジル基、3、5-ジトリフル オロメチルベンジルアミノベンジル基、2,3,4,5,6-ペンタフルオロベ ンジルアミノベンジル基、4ーイソプロポキシベンジルアミノベンジル基、4n-ブトキシベンジルアミノベンジル基、4-メトキシベンジルアミノベンジル 基、2-メトキシベンジルアミノベンジル基、3-メトキシベンジルアミノベン 25 ジル基、2,4-ジメトキシベンジルアミノベンジル基、2,3-ジメトキシベ ンジルアミノベンジル基、2,6-ジメトキシベンジルアミノベンジル基、3. 5-ジメトキシベンジルアミノベンジル基、2,5-ジメトキシベンジルアミノ ベンジル基、2, 4, 6ートリメトキシベンジルアミノベンジル基、3.5-ジ

トリフルオロメトキシベンジルアミノベンジル基、2-イソプロポキシベンジル アミノベンジル基、3-クロロー4-メトキシベンジルアミノベンジル基、2-クロロー4ートリフルオロメトキシベンジルアミノベンジル基、3ーメチルー4 ーフルオロベンジルアミノベンジル基、4ーブロモー3ートリフルオロメチルベ ンジルアミノベンジル基、2-トリフルオロメチルベンジル基、アミノベンジル 基、3-トリフルオロメチルベンジルアミノベンジル基、4-トリフルオロメチ ルベンジルアミノベンジル基、2-ペンタフルオロエトキシベンジルアミノベン ジル基、3-ペンタフルオロエトキシベンジルアミノベンジル基、4-ペンタフ ルオロエトキシベンジルアミノベンジル基、2-トリフルオロメトキシベンジル アミノベンジル基、3-トリフルオロメトキシベンジルアミノベンジル基、4-10 トリフルオロメトキシベンジルアミノベンジル基、2ーペンタフルオロエトキシ ベンジルアミノベンジル基、3ーペンタフルオロエトキシベンジルアミノベンジ ル基、4ーペンタフルオロエトキシベンジルアミノベンジル基、3ー(N-メチ ルーN-ベンジルアミノ)ベンジル基、4-(ジベンジルアミノ)ベンジル基、 - 2-ジメチルアミノベンジル基、3-ジメチルアミノベンジル基、4-ジメチル 15 アミノベンジル基、2-(2-ジメチルアミノフェニル)エチル基、2-(3-ジメチルアミノフェニル) エチル基、2-(4-ジメチルアミノフェニル) エチ ル基、3-(2-ジメチルアミノフェニル)プロピル基、3-(3-ジメチルア ミノフェニル)プロピル基、3-(4-ジメチルアミノフェニル)プロピル基、 2-フェノキシベンジル基、2、3-ジフェノキシベンジル基、2、4、6-ト 20 イリフェノキシベンジル基、2-(2-フルオロフェノキシ)ベンジル基、3-(3-フルオロフェノキシ) ベンジル基、4-(4-フルオロフェノキシ) ベン ジル基、2-(2-クロロフェノキシ)ベンジル基、3-(3-クロロフェノキ シ) ベンジル基、4-(4-クロロフェノキシ) ベンジル基、2-(2-ブロモ フェノキシ)ベンジル基、3-(3-ブロモフェノキシ)ベンジル基、4-(4 25 ーブロモフェノキシ)ベンジル基、2-(2-ヨードフェノキシ)ベンジル基、

3-(3-ヨードフェノキシ)ベンジル基、4-(4-ヨードフェノキシ)ベン

ジル基、3-(2,3-ジフルオロフェノキシ)ベンジル基、4-(3,4-ジ

フルオロフェノキシ)ベンジル基、2-(3,5-ジフルオロフェノキシ)ベン

ジル基、4-(2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェノキシ)ベンジル基、 2-(2,4-ジフルオロフェノキシ)ベンジル基、4-(2,6-ジフルオロ フェノキシ) ベンジル基、3-(2,3-ジクロロフェノキシ) ベンジル基、2 - (3,4-ジクロロフェノキシ)ベンジル基、4-(3,5-ジクロロフェノ 5 キシ) ベンジル基、3-(2,4-ジクロロフェノキシ) ベンジル基、4-(2, 6-ジクロロフェノキシ)ベンジル基、4-(2-フルオロ-4-ブロモフェノ キシ) ベンジル基、3-(4-クロロ-3-フルオロフェノキシ) ベンジル基、 4-(2,3,4-トリクロロフェノキシ)ベンジル基、4-(3,4,5-ト リフルオロフェノキシ) ベンジル基、4-(2,4,6-トリクロロフェノキ シ) ベンジル基、2-(4-イソプロピルフェノキシ) ベンジル基、3-(4-10 n-ブチルフェノキシ) ベンジル基、4-(4-メチルフェノキシ) ベンジル基、 3-(2-メチルフェノキシ)ベンジル基、2-(3-メチルフェノキシ)ベン ジル基、2-(2,4-ジメチルフェノキシ)ベンジル基、3-(2,3-ジメ チルフェノキシ)ベンジル基、4-(2,6-ジメチルフェノキシ)ベンジル基、 2-(3,5-ジメチルフェノキシ)ベンジル基、3-(2,5-ジメチルフェ 15 ノキシ)ベンジル基、2-(2、4、6-トリメチルフェノキシ)ベンジル基、 3-(3,5-ジトリフルオロメチルフェノキシ)ベンジル基、4-(2,3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェノキシ) ベンジル基、2-(4-イソプロポキ シフェノキシ) ベンジル基、2-(4-n-ブトキシフェノキシ) ベンジル基、 2- (4-メトキシフェノキシ) ベンジル基、3- (2-メトキシフェノキシ) 20 ベンジル基、4-(3-メトキシフェノキシ)ベンジル基、2-(2,4-ジメ トキシフェノキシ) ベンジル基、3-(2,3-ジメトキシフェノキシ) ベンジ ル基、4-(2,6-ジメトキシフェノキシ)ベンジル基、2-(3,5-ジメ トキシフェノキシ) ベンジル基、3-(2,5-ジメトキシフェノキシ) ベンジ ル基、4-(2,4,6-トリメトキシフェノキシ)ベンジル基、2-(3,5 25ージトリフルオロメトキシフェノキシ) ベンジル基、3-(2-イソプロポキシ フェノキシ) ベンジル基、4-(3-クロロ-4-メトキシフェノキシ) ベンジ ル基、3-(2-クロロー4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ベンジル基、

2- (3-メチル-4-フルオロフェノキシ) ベンジル基、3- (4-ブロモ-

3-トリフルオロメチルフェノキシ)ベンジル基、4-(2-トリフルオロメチ ルフェノキシ)ベンジル基、2-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)ベンジ ル基、3-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ベンジル基、4-(2-ペン タフルオロエトキシフェノキシ)ベンジル基、2-(3-ペンタフルオロエトキ シフェノキシ)ベンジル基、3-(4-ペンタフルオロエトキフェノキシ)ベン ジル基、4-(2-トリフルオロメトキシフェノキシ)ベンジル基、2-(3-トリフルオロメトキシフェノキシ)ベンジル基、3-(4-トリフルオロメトキ シフェノキシ)ベンジル基、4-(2-ペンタフルオロエトキシフェノキシ)ベ ンジル基、2-(3-ペンタフルオロエトキシフェノキシ)ベンジル基、3-(4-ペンタフルオロエトキシフェノキシ) ベンジル基、2- [3-(2-トリ 10 フルオロメチルフェノキシ) フェニル] エチル基、2--[3--(3--トリフルオ ロメチルフェノキシ)フェニル]エチル基、2-[4-(4-トリフルオロメチル フェノキシ)フェニル]エチル基、3-[4-(2-トリフルオロメチルフェノ キシ)フェニル]プロピル基、4-[3-(3-ペンタフルオロエトキシフェノ 15 キシ)フェニル]ブチル基、5-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) フェニル]ペンチル基、6-「2-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)フェ ニル〕へキシル基、4−(1−ピペラジニル)ベンジル基、4−(1−ピペリジ ニル) ベンジル基、4-(4-ベンジル-1-ピペラジニ) ベンジル基、4-(4-(3-クロロベンジル)-1-ピペラジニル)ベンジル基、4-(4-(2. 4-ジメチルベンジル)-1-ピペラジニル)ベンジル基、4-(4-20 (2, 4-ジメチルベンジル) -1-ピペラジニル) ベンジル基、4-(2, 4 ージベンジルー1-ピペラジニル)ベンジル基、4-(2,3,4-トリベンジ ルー1-ピペラジニル) ベンジル基、4-(4-(4-トリフルオロメトキシベ ンジル) -1-ピペラジニル) ベンジル基、4-(4-アニリノー1-ピペリジ ニル)ベンジル基、4-(4-(3-トリフルオロメチルベンジル)-1-ピペ 25ラジニル) ベンジル基、4- 「4- (N-メチルアニリノ) -1-ピペリジニ ル] ベンジル基、4-[4-(N-メチル-3-クロロアニリノ)-1-ピペリ ジニル]ベンジル基、4-[4-(2,4-ジメチルアニリノ)-1-ピペリジ

ニル] ベンジル基、4-[4-(N-メチル-2, 4, 6-トリメトキシアニリ

ノ)-1-ピペリジニル] ベンジル基、4-[4-(4-トリフルオロメトキシ アニリノ) -1-ピペリジニル] ベンジル基、4-[4-(N-メチル-3-ト リフルオロメチルアニリノ) -1-ピペリジニル] ベンジル基、4-(3,4-ジアニリノー1ーピペリジニル) ベンジル基、4-(3,4,5-トリアニリノ - 1 - ピペリジニル)ベンジル基等のフェニルC 1 ~ 6 アルキル基(フェニル環 上には、フェノキシ基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしく は未置換С1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のС1~6アルコ キシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していて もよい];ハロゲン原子;ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基; ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基;アミノ基(アミノ基上に 10 は、C1~6アルキル基及びフェニルC1~6アルキル基[フェニル環上には、 ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置 換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基からなる群 より選ばれた基が $1\sim5$ 個、好ましくは $1\sim3$ 個置換していてもよい]からなる 群より選ばれた基が1~2個置換していてもよい);ピペラジニル基[ピペラジ 15 ン環上には、置換基としてフェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハ ロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換 もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基が $1\sim5$ 個、 好ましくは $1\sim3$ 個置換していてもよい)が $1\sim3$ 個置換していてもよい]及び ピペリジル基 [ピペリジン環上には、1~3個のアミノ基が置換していてもよい。 20 該アミノ基上には、フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置 換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~ 6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換 していてもよい)及びC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基が1~2個 置換していてもよい。] なる群より選ばれた基が $1\sim5$ 個、好ましくは $1\sim3$ 個 25 置換していてもよい)を挙げることができる。

アミノC1~6アルキル基(アミノ基上には、C1~6アルキル基、C1~6アルコキシカルボニル基及びフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子もしくはハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基からなる群より選ばれた

基の少なくとも1種が置換していてもよい]からなる群より選ばれた基の少なく とも1種が置換していてもよい)としては、例えば、アミノメチル基、2-アミ ノエチル基、1-アミノエチル基、3-アミノプロピル基、4-アミノブチル基、 5-アミノペンチル基、6-アミノヘキシル基、2-メチル-3-アミノプロピ ル基、1,1-ジメチル-2-アミノエチル基、2-(メチルアミノ)エチル基、 3- (メチルアミノ) プロピル基、4- (メチルアミノ) ブチル基、5- (メチ ルアミノ) ペンチル基、6-(メチルアミノ) ヘキシル基、2-(N-メチル-N-メトキシカルボニルアミノ) エチル基、3-(N-メチル-N-メトキシカ ルボニルアミノ)プロピル基、4-(N-メチル-N-メトキシカルボニルアミ ノ)ブチル基、5-(N-メチル-N-メトキシカルボニルアミノ)ペンチル基、 10 6- (N-メチル-N-メトキシカルボニルアミノ) ヘキシル基、2- (N-エ トキシカルボニル-N-メチルアミノ)) エチル基、3-(N-エトキシカルボ ニル-N-メチルアミノ)プロピル基、4-(N-エトキシカルボニル-N-メ チルアミノ) ブチル基、5-(N-エトキシカルボニル-N-メチルアミノ) ペー ンチル基、6-(N-エトキシカルボニル-N-メチルアミノ)) ヘキシル基、 15 2- [N-メチル-N-(n-プロポキシカルボニルアミノ)] エチル基、3-[N-メチル-N-(n-プロポキシカルボニルアミノ)] プロピル基、4-[N-メチル-N-(N-プロポキシカルボニルアミノ)]ブチル基、5-[N -メチル-N- (n-プロポキシカルボニルアミノ)] ペンチル基、6- [N-メチル-N- (n-プロポキシカルボニルアミノ)] ヘキシル基、2- [N-20 (tert-ブトキシカルボニル) -N-メチルアミノ] エチル基、3- [N-(tertーブトキシカルボニル) -N-メチルアミノ] プロピル基、4- [N - (tert-ブトキシカルボニル)-N-メチルアミノ]ブチル基、5-[N - (tert-ブトキシカルボニル)-N-メチルアミノ]ペンチル基、6-[N-(tert-ブトキシカルボニル)-N-メチルアミノ] ヘキシル基、2 25 - [N-メチル-N- (n-ペントキシカルボニル) アミノ] エチル基、2-[N-メチル-N-(n-ヘキシルオキシカルボニル)アミノ] エチル基、2-(N-メチルアニリノ) エチル基、3-(N-メチルアニリノ) プロピル基、4 - (N-メチルアニリノ) ブチル基、2- (N-メチル-4-クロロアニリノ)

エチル基、3-(N-メチル-4-クロロアニリノ)プロピル基、4-(N-メ チルー4ークロロアニリノ)ブチル基、2-(4-フルオロ-N-メチルアニリ ノ) エチル基、3-(4-フルオロ-N-メチルアニリノ) プロピル基、2-(3-フルオローN-メチルアニリノ) エチル基、3-(3-フルオローN-メ - チルアニリノ) プロピル基、4- (3-フルオロ-N-メチルアニリノ)ブチル 基、2-(2-フルオローN-メチルアニリノ)エチル基、3-(2-フルオロ Nーメチルアニリノ)プロピル基、4-(2-フルオローNーメチルアニリ ノ)ブチル基、2-(2-クロローN-メチルアニリノ)エチル基、3-(2-クロローNーメチルアニリノ)プロピル基、4-(2-クロローN-メチルアニ 10 リノ)ブチル基、2-(3-クロロ-N-メチルアニリノ)エチル基、3-(3 -クロロ-N-メチルアニリノ) プロピル基、4-(3-クロロ-N-メチルア ニリノ)ブチル基、2ー(4ートリフルオロメチルーNーメチルアニリノ)エチ ル基、2-(4-メチルアニリノ)エチル基、2-(3,5-ジトリフルオロメ チル-N-エトキシカルボニルアニリノ)エチル基、2-(3,5-ジトリフル オロメチルーNーメチルアニリノ) エチル基、2-(2, 4-ジメチルーNーメ 15 チルアニリノ) エチル基、2-(3,5-ジメトキシ-N-メチルアニリノ) エ チル基、2-(2,4,6-トリメチルアニリノ)エチル基、2-(3,4,5 ートリメトキシアニリノ) エチル基、3-(4-トリフルオロメチル-N-メチ ルアニリノ)プロピル基、4-(4-トリフルオロメチル-N-メチルアニリ ノ) ブチル基、2-(3-トリフルオロメチル-N-メチルアニリノ) エチル基、 20 3-(3-トリフルオロメチル-N-メチルアニリノ)プロピル基、2-(2-トリフルオロメチル-N-メチルアニリノ) エチル基、3-(2-トリフルオロ メチル- N - メチルアニリノ) プロピル基、4- (2 - トリフルオロメチルー N ーメチルアニリノ)ブチル基、2-(4-トリフルオロメトキシ-N-メチルア ニリノ) エチル基、3-(4-トリフルオロメトキシ-N-メチルアニリノ) プ 25ロピル基、4-(4-トリフルオロメトキシ-N-メチルアニリノ)ブチル基、 2-(3-トリフルオロメトキシーNーメチルアニリノ)エチル基、3-(3-トリフルオロメトキシーN-メチルアニリノ)プロピル基、4-(3-トリフル

オロメトキシーN-メチルアニリノ)ブチル基、2-(2-トリフルオロメトキ

シーNーメチルアニリノ)エチル基、3-(2-トリフルオロメトキシーNーメチルアニリノ)プロピル基、4-(2-トリフルオロメトキシーNーメチルアニリノ)ブチル基、3-(4-メトキシーNーメチルアニリノ)エチル基、3-(4-メトキシーNーメチルアニリノ)プロピル基、4-(4-メトキシーNーメチルアニリノ)ブロピル基、4-(4-メトキシーNー5メチルアニリノ)ブチル基、2-(3-メトキシーNーメチルアニリノ)エチル基、3-(3-メトキシーNーメチルアニリノ)プロピル基、4-(3-メトキシーNーメチルアニリノ)ブチル基、2-(2-メトキシーNーメチルアニリノ)プロピル基、4-(2-メトキシーNーメチルアニリノ)プロピル基、4-(2-メトキシーNーメチルアニリノ)ブチル基等のアミノC1~6アルキル基10(アミノ基上には、C1~6アルキル基、C1~6アルコキシカルボニル基及びフェニル基[フェニル環上には、ハロゲンもしくはハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい]からなる群から選ばれた基が1~2個置換していてもよい)を挙げることができる。

フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、フェノキシ基[フェニル環上 15 には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロ ゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少 なくとも1種が置換していてもよい]及びC1~6アルコキシカルボニル基から なる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例え 20 ば、フェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フル オロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフ ェニル基、2-ブロモフェニル基、3-ブロモフェニル基、4-ブロモフェニル 基、2-ヨードフェニル基、3-ヨードフェニル基、4-ヨードフェニル基、2, 3-ジフルオロフェニル基、3,4-ジフルオロフェニル基、3,5-ジフルオ ロフェニル基、2,4-ジフルオロフェニル基、2,6-ジフルオロフェニル基、 25 2, 3-ジクロロフェニル基、3, 4-ジクロロフェニル基、3, 5-ジクロロ フェニル基、2, 4-ジクロロフェニル基、2, 6-ジクロロフェニル基、2, 3、4-トリフルオロフェニル基、3、4、5-トリフルオロフェニル基、3、 4、5-トリクロロフェニル基、2、4、6-トリフルオロフェニル基、2、3、

4, 5, 6ーペンタフルオロフェニル基、2, 4, 6ートリクロロフェニル基、 2-フルオロー4ークロロフェニル基、2-フルオロー4ーブロモフェニル基、 3-フルオロー4-クロロフェニル基、2-メトキシカルボニルフェニル基、3 -メトキシカルボニルフェニル基、4-メトキシカルボニルフェニル基、2,4 - ジメトキシカルボニルフェニル基、2,4,6-トリメトキシカルボニルフェ ニル基、2-エトキシカルボニルフェニル基、3-エトキシカルボニルフェニル 基、4-エトキシカルボニルフェニル基、2-プロポキシカルボニルフェニル基、 3-プロポキシカルボニルフェニル基、4-プロポキシカルボニルフェニル基、 2-ブトキシカルボニルフェニル基、3-ブトキシカルボニルフェニル基、4-ブトキシカルボニルフェニル基、4ーペントキシカルボニルフェニル基、4ーへ 10 キシルオキシカルボニルフェニル基、2-フェノキシフェニル基、3-フェノキ シフェニル基、4ーフェノキシフェニル基、2-(2-クロロフェノキシ)フェ ニル基、2-(3-クロロフェノキシ)フェニル基、2-(4-クロロフェノキ シ)フェニル基、3-(2-クロロフェノキシ)フェニル基、3-(3-クロロ フェノキシ)フェニル基、3-(4-クロロフェノキシ)フェニル基、4-(2 15 ークロロフェノキシ)フェニル基、4-(2,4-ジクロロフェノキシ)フェニ ル基、4-(2,4,6-トリクロロフェノキシ)フェニル基、4-(3-クロ ロフェノキシ)フェニル基、4-(4-クロロフェノキシ)フェニル基、2-(2-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、2-(3-トリフルオロメ 20 チルフェノキシ)フェニル基、2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)フェ ニル基、3-(2-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、3-(2-メ チルフェノキシ)フェニル基、3-(2,4-ジメチルフェノキシ)フェニル基、 3-(2,4,6-トリメチルフェノキシ)フェニル基、3-(2-メトキシフ ェノキシ)フェニル基、3-(2,4-ジメトキシフェノキシ)フェニル基、3 - (2, 4, 6-トリメトキシフェノキシ) フェニル基、2-(3, 5-ジトリ 25フルオロメチルフェノキシ)フェニル基、2- (3, 5-ジトリフルオロメトキ シフェノキシ)フェニル基、3-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニ ル基、3-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、4-(2-トリ フルオロメチルフェノキシ)フェニル基、4-(3-トリフルオロメチルフェノ

キシ)フェニル基、4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、2-(3-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、2-(3-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、4-(2-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、第のフェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、フェノキシ基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン原子、フェノキシ基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい)及びC1~6アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

フェニルC1~6アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、 15 ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未 置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換 していてもよい)としては、例えば、例えばベンジルオキシカルボニル基、1-フェネチルオキシカルボニル基、2-フェネチルオキシカルボニル基、3-フェ 20 ニルプロポキシカルボニル基、2-フェニルプロポキシカルボニル基、4-フェ ニルブトキシカルボニル基、5-フェニルペンチルオキシカルボニル基、4-フ ェニルペンチルオキシカルボニル基、6-フェニルヘキシルオキシカルボニル、 2-フルオロベンジルオキシカルボニル基、3-フルオロベンジルオキシカルボ ニル基、4ーフルオロベンジルオキシカルボニル基、2ークロロベンジルオキシ カルボニル基、3-クロロベンジルオキシカルボニル基、4-クロロベンジルオ 25 キシカルボニル基、2-ブロモベンジルオキシカルボニル基、3-ブロモベンジ ルオキシカルボニル基、4ーブロモベンジルオキシカルボニル基、2ーヨードベ ンジルオキシカルボニル基、3-ヨードベンジルオキシカルボニル基、4-ヨー ドベンジルオキシカルボニル基、2,3-ジフルオロベンジルオキシカルボニル

基、3、4ージフルオロベンジルオキシカルボニル基、3、5ージフルオロベン ジルオキシカルボニル基、2,4-ジフルオロベンジルオキシカルボニル基、2, 6-ジフルオロベンジルオキシカルボニル基、2,4,6-トリフルオロベンジ ルオキシカルボニル基、2,3,4,5,6-ペンタフルオロベンジルオキシカ 5 ルボニル基、3,4,5-トリフルオロベンジルオキシカルボニル基、2,3-ジクロロベンジルオキシカルボニル基、3、4-ジクロロベンジルオキシカルボ ニル基、3,5-ジクロロベンジルオキシカルボニル基、2,4-ジクロロベン ジルオキシカルボニル基、2,6-ジクロロベンジルオキシカルボニル基、2, 4, 6-トリクロロベンジルオキシカルボニル基、3, 4, 5-トリクロロベン ジルオキシカルボニル基、パーフルオロベンジルオキシカルボニル基、2-ジフ 10 ルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、3-メチルベンジルオキシカルボニ ル基、3,5-ジメチルベンジルオキシカルボニル基、2,4,6-トリメチル ベンジルオキシカルボニル基、3-メトキシベンジルオキシカルボニル基、3, 5 - ジメトキシベンジルオキシカルボニル基、2,4,6-トリメトキシベンジ ルオキシカルボニル基、3-ジフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、4 ージフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、4-クロロー3-ジフルオロ メチルベンジルオキシカルボニル基、3-クロロ-4-ジフルオロメチルベンジ ルオキシカルボニル基、3-ブロモー4-ジフルオロメチルベンジルオキシカル ボニル基、3,5-ジフルオロ-4-ジフルオロメチルベンジルオキシカルボニ ル基、2-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、3-トリフルオロ 20 メチルベンジルオキシカルボニル基、4-トリフルオロメチルベンジルオキシカ ルボニル基、4-フルオロ-3-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル 基、3-フルオロー4-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、2-ペンタフルオロエチルベンジルオキシカルボニル基、4-クロロー3-ペンタフ ルオロエチルベンジルオキシカルボニル基、3-クロロ-4-ペンタフルオロエ 25 チルベンジルオキシカルボニル基、2-ペンタフルオロエチルベンジルオキシカ ルボニル基、3-ペンタフルオロエチルベンジルオキシカルボニル基、4-ペン タフルオロエチルベンジルオキシカルボニル基、2-トリフルオロメトキシベン ジルオキシカルボニル基、3-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル

基、4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、4-フルオロ-3 ートリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、3-フルオロ-4-トリ フルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、2-ペンタフルオロエトキシベ ンジルオキシカルボニル基、3-ペンタフルオロエトキシベンジルオキシカルボ ニル基、4ーペンタフルオロエトキシベンジルオキシカルボニル基、3ークロロ - 4 - トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、3 - クロロー4 - ペ ンタフルオロエトキシベンジルオキシカルボニル基、2-(2-トリフルオロメ チルフェニル)エトキシカルボニル基、2-(3-トリフルオロメチルフェニ ル) エトキシカルボニル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル) エトキシ カルボニル基、(2ートリフルオロメトキシフェニル)メトキシカルボニル基、 10 (3-トリフルオロメトキシフェニル) メトキシカルボニル基、2-(4-トリ フルオロメトキシフェニル)エメトキシカルボニル基、2-(2-ペンタフルオ ロエトキシフェニル)エトキシカルボニル基、2-(3-ペンタフルオロエトキ シフェニル) エトキシカルボニル基、2-(4-ペンタフルオロエトキシフェニ ル) エトキシカルボニル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル) プロポキ シカルボニル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシカルボニ ル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル) プロポキシカルボニル基、3-(3-トリ フルオロメトキシフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(4-トリフルオロ メトキシフェニル)プロポキシカルボニル基、3- (3-ペンタフルオロエトキ 20 シフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(4-ペンタフルオロエトキシフェ ニル)プロポキシカルボニル基、4-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル) ブトキシカルボニル基、5-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチルオキ シカルボニル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル) ペンチルオキシカル ボニル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ペンチルオキシカルボニ 25 ル基、6-(3-トリフルオロメチルフェニル) ヘキシルオキシカルボニル基、 6-(4-トリフルオロメチルフェニル) ヘキシルオキシカルボニル基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ヘキシルオキシカルボニル基、等のフェ ニルC1~6アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロ

ゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基が $1\sim5$ 個、好ましくは $1\sim6$ 3 個置換していてもよい)を挙げることができる。

フェニルC1~6アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、 5 シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換 もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1種が置換されていてもよい)としては、例えば、ベンジルオキシカルボニル基、 フェニルエトキシカルボニル基、3-フェニルプロポキシカルボニル基、2-フ ェニルプロポキシカルボニル基、4-フェニルブトキシカルボニル基、5-フェ ニルペントキシカルボニル基、4-フェニルペントキシカルボニル基、6-フェ 10 ニルヘキシルオキシカルボニル基、2-フルオロベンジルオキシカルボニル基、 3-フルオロベンジルオキシカルボニル基、4-フルオロベンジルオキシカルボ ニル基、2-(2-フルオロフェニル)エトキシカルボニル基、1-(3-フル オロフェニル) エトキシカルボニル基、2-(4-フルオロフェニル) エトキシ カルボニル基、2-クロロベンジルオキシカルボニル基、3-クロロベンジルオ キシカルボニル基、4-クロロベンジルオキシカルボニル基、2-(2-ブロモ フェニル)エトキシカルボニル基、1-(3-クロロフェニル)エトキシカルボ ニル基、2-(4-ヨードフェニル)エトキシカルボニル基、2-(2,3-ジ クロロフェニル)エトキシカルボニル基、(2,4,6ートリクロロフェニル) 20 - メトキシカルボニル基、(2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニル)メト キシカルボニル基、2-シアノベンジルオキシカルボニル基、3-シアノベンジ ルオキシカルボニル基、4-シアノベンジルオキシカルボニル基、2,4-ジシ アノベンジルオキシカルボニル基、3、4、5-トリシアノベンジルオキシカル ボニル基、2-シアノフェニルエトキシカルボニル基、3-シアノフェニルエト キシカルボニル基、4ーシアノフェニルエトキシカルボニル基、2-メチルベン 25ジルオキシカルボニル基、2,4-ジメチルベンジルオキシカルボニル基、2. 4.6-トリメチルベンジルオキシカルボニル基、2-トリフルオロメチルベン ジルキシカルボニル基、3-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、 4-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、2-メトキシベンジルオ

キシカルボニル基、2,4-ジメトキシベンジルオキシカルボニル基、2,4, 6-トリメトキシベンジルオキシカルボニル基、2-トリフルオロメトキシベン ジルオキカルボニル基、3-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、 4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、2-(2-トリフルオ ロメチルフェニル)エトキシカルボニル基、2-(3-トリフルオロメチルフェ ニル) エトキシカルボニル基、2- (4-トリフルオロメチルフェニル) エトキシ カルボニル基、2-(2-トリフルオロメトキシフェニル)エトキシカルボニル 基、2-(3-トリフルオロメトキシフェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニル) エトキシカルボニル基、3-(2-トリ フルオロメチルフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(3-トリフルオロメ 10 チルフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニ ル)プロポキシカルボニル基、3-(2-トリフルオロメトキシフェニル)プロ ポキシカルボニル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェニル)プロポキシカ ルボニル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)プロポキシカルボニル・ 基、3-(4-ビフェニリル)プロポキシカルボニル基、4-(4-ビフェニリ 15 ル) ブトキシカルボニル基、5-(4-ビフェニリル) ペントキシカルボニル基、 4-(3-トリフルオロメチルフェニル)ブトキシカルボニル基、5-(4-ト リフルオロメチルフェニル)ペントキシカルボニル基、4-(4-トリフルオロ メチルフェニル)ペントキシカルボニル基、4-(4-トリフルオロメトキシフ ェニル)ペントキシカルボニル基、6-(3-トリフルオロメチルフェニル)へ 20キシルオキシカルボニル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル) ヘキシル オキシカルボニル基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ヘキシルオキ シカルボニル基等のフェニルC1~6アルコキシカルボニル基(フェニル環上に は、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル 基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ば 25 れた基が1~5個、好ましくは1~3個置換されていてもよい)を挙げることが できる。

フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子及びハロゲン 置換もしくは未置換のC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくと も1種が置換していてもよい)とは、無置換のフェニルC1~6アルキル基及びそれらの基を構成するフェニル環がハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換されている基であって、例えば、ベンジル基、1ーフェネチル基、2ーフェネチル基、3ーフェニルプロピル基、2ーフェニルプロピル基、4ーフェニルブチル基、5ーフェニルペンチル基、4ーフェニルでシャル基、5ーフェニルペンチル基、3ーフルオロベンジル基、4ーフルオロベンジル基、2ークロロベンジル基、3ークロロベンジル基、4ークロロベンジル基、2ープロモベンジル基、3ープロモベンジル基、4ープロモベンジル基、

- 10 2-ヨードベンジル基、3-ヨードベンジル基、4-ヨードベンジル基、2,3 ージフルオロベンジル基、3,4-ジフルオロベンジル基、3,5-ジフルオロ ベンジル基、2,4-ジフルオロベンジル基、2,6-ジフルオロベンジル基、 2,3,4,5,6-ペンタフルオロベンジル基、2,3-ジクロロベンジル基、 3,4-ジクロロベンジル基、3,5-ジクロロベンジル基、2,4-ジクロロ
- 15 ベンジル基、2,6ージクロロベンジル基、2ートリフルオロメチルベンジル基、3ートリフルオロメチルベンジル基、4ートリフルオロメチルベンジル基、2ーメチルベンジル基、2,3ージメチルベンジル基、2,4,6ートリメチルベンジル基、3,5ージトリフルオロメチルベンジル基、2ー(2ートリフルオロメチルフェニル)エチル基、チルフェニル)エチル基、2ー(3ートリフルオロメチルフェニル)エチル基、
- 20 2-(4-トリフルオロメチルフェニル) エチル基、3-(2-トリフルオロメ チルフェニル) プロピル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル) プロピル 基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル) プロピル基、3-(2-トリフル オロメチルフェニル) プロピル基、5-(4-トリフルオロメチルフェニル) ペ ンチル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル) ペンチル基、6-(3-ト
- 25 リフルオロメチルフェニル)へキシル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル)へキシル基等を挙げることができる。

ピペリジニルC1~6アルキル基(ピペリジン環上には、少なくとも1個のフェノキシ基(フェニル環上には、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい)が置換していてもよい)としては、例え

ば、ピペリジン-1-イルメチル基、ピペリジン-2-イルエチル基、ピペリジ ンー3-イルプロピル基、ピペリジンー4-イルブチル基、ピペリジンー1-イ ルペンチル基、ピペリジンー2ーイルヘキシル基、4ーフェノキシピペリジンー 1-イルメチル基、2-(4-フェノキシピペリジン-1-イル) エチル基、3 - - (4-フェノキシピペリジン-1-イル) プロピル基、4- (4-フェノキシ ピペリジン-1-イル) ブチル基、5-(4-フェノキシピペリジン-1-イ ル)ペンチル基、6-(4-フェノキシピペリジン-1-イル)へキシル基、4 - (3-メチルフェノキシ) ピペリジン-1-イルメチル基、4-(2,5-ジ メチルフェノキシ) ピペリジンー1ーイルメチル基、4-(2,4,6-トリメ チルフェノキシ)ピペリジンー1-イルメチル基、4-(3,5-ジトリフルオ 10 ロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イルメチル基、4-(2-トリフルオロ メチルフェノキシ) ピペリジンー1ーイルメチル基、2ー [4ー(2ートリフル オロメチルフェノキシ) ピペリジン-1-イル] エチル基、3-[4-(2-ト リフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル]プロピル基、4-[4-(2-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル] ブチル基、5-15 [4-(2-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル]ペンチル 基、6-[4-(2-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル] ヘキシル基、4-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル メチル基、2-[4-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル] エチル基、3- [4-(3-トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジン 20 -1-イル] プロピル基、4-[4-(3-トリフルオロメチルフェノキシ) ピ ペリジン-1-イル]ブチル基、5-[4-(3-トリフルオロメチルフェノキ シ) ピペリジン-1-イル] ペンチル基、6-[4-(3-トリフルオロメチル フェノキシ) ピペリジン-1-イル] ヘキシル基、4-(4-トリフルオロメチ ルフェノキシ) ピペリジン-1-イルメチル基、2-[4-(4-トリフルオロ 25 メチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル]エチル基、3-[4-(4-トリフ ルオロメチルフェノキシ) ピペリジン-1-イル] プロピル基、4-[4-(4 --トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル]ブチル基、5-「4 - (4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル]ペンチル基、

6-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル]へキシル基等のピペリジニルC1~6アルキル基(ピペリジン環上には、置換基としてフェノキシ基(フェニル環上には、置換基としてハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基が1~5個、好ましくは1~3個有していてもよい)を少なくとも1個有していてもよい)を挙げることができる。

とも1個有していてもよい)を挙げることができる。 フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子:ハロゲン置換もしくは未置換 のC1~6アルキル基;ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基; 置換基としてC1~6アルキル基及びフェニルC1~6アルキル基[フェニル環 上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハ ロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の 10 少なくとも1種が置換していてもよい] からなる群より選ばれる基を有すること のあるアミノ基:フェノキシ基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置 換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~ 6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよ い];フェニルC1~6アルコキシ基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロ ゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換してい てもよい〕及びピペリジル基「ピペリジン環上には、少なくとも1個のアミノ基 が置換していてもよい。該アミノ基上には、フェニルC1~6アルキル基(フェ 20 ニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基 及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれ た基の少なくとも1種が置換していてもよい)及びC1~6アルキル基なる群よ り選ばれる基の少なくとも1種が置換していてもよい。〕からなる群より選ばれ た基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、フェニル基、 2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、 25 2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2-ブ ロモフェニル基、3-ブロモフェニル基、4-ブロモフェニル基、2-ヨードフ ェニル基、3-ヨードフェニル基、4-ヨードフェニル基、2、3-ジフルオロ フェニル基、3,4ージフルオロフェニル基、3,5ージフルオロフェニル基、

2, 4-ジフルオロフェニル基、2, 6-ジフルオロフェニル基、2, 3-ジク ロロフェニル基、3,4ージクロロフェニル基、3,5ージクロロフェニル基、 2, 4-ジクロロフェニル基、2, 6-ジクロロフェニル基、3, 4, 5-トリ フルオロフェニル基、3,4,5ートリクロロフェニル基、2,4,6ートリフ ルオロフェニル基、2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニル基、2,4, 6-トリクロロフェニル基、2-メチルフェニル基、3-メチルフェニル基、4 - メチルフェニル基、2, 4 - ジメチルフェニル基、3, 4, 5 - トリメチルフ ェニル基、3,5-ジトリフルオロメチルフェニル基、2-メチル-3-クロロ フェニル基、3-メチル-4-クロロフェニル基、2-クロロー4-メチルフェ ニル基、2-メチルー3-フルオロフェニル基、2-トリフルオロメチルフェニ 10 ル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、 2-ペンタフルオロエチルフェニル基、3-ペンタフルオロエチルフェニル基、 4ーペンタフルオロエチルフェニル基、2ーイソプロピルフェニル基、3ーイソ プロピルフェニル基、4ーイソプロピルフェニル基、2-tert-ブチルフェ ニル基、3-tert-ブチルフェニル基、4-tert-ブチルフェニル基、 15 2-secーブチルフェニル基、3-secーブチルフェニル基、4-secー ブチルフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、3-n-ヘプ タフルオロプロピルフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、 4-ペンチルフェニル基、4-ヘキシルフェニル基、2-メトキシフェニル基、 3-メトキシフェニル基、4-メトキシフェニル基、2-メトキシー3-クロロ 20 フェニル基、2-フルオロ-3-メトキシフェニル基、2-フルオロ-4-メト キシフェニル基、2,6-ジメトキシフェニル基、2,4,6-トリメトキシフ ェニル基、3,5-ジトリフルオロメトキシフェニル基、2-トリフルオロメト キシフェニル基、3ートリフルオロメトキシフェニル基、4ートリフルオロメト キシフェニル基、2-ペンタフルオロエトキシフェニル基、3-ペンタフルオロ 25エトキシフェニル基、4ーペンタフルオロエトキシフェニル基、2ーイソプロポ キシフェニル基、3ーイソプロポキシフェニル基、4ーイソプロポキシフェニル 基、2-tert-ブトキシフェニル基、3-tert-ブトキシフェニル基、

4-tertーブトキシフェニル基、2-secーブトキシフェニル基、3-

secーブトキシフェニル基、4-secーブトキシフェニル基、2-n-ヘプ タフルオロプロポキシフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル 基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-ペンチルオキシフェニ ル基、4-ヘキシルオキシフェニル基、3-アミノフェニル基、3-メチルアミ 5 ノフェニル基、3-ジメチルアミノフェニル基、4-メチルアミノフェニル基、 4ージメチルアミノフェニル基、4ーエチルアミノフェニル基、4ージエチルア ミノフェニル基、4-n-プロピルアミノフェニル基、4-ジ-n-プロピルア ミノフェニル基、4-n-ブチルアミノフェニル基、4-ジーn-ブチルアミノ フェニル基、4-n-ペンチルアミノフェニル基、4-ジ-n-ペンチルアミノ 10 フェニル基、4-n-ヘキシルアミノフェニル基、4-ジ-n-ヘキシルアミノ フェニル基、4ーベンジルアミノフェニル基、4ー(2ーフルオロベンジルアミ ノ)フェニル基、4-(3-フルオロベンジルアミノ)フェニル基、4-(4-フルオロベンジルアミノ)フェニル基、4-(2,3-ジフルオロベンジルアミ ノ)フェニル基、4ー(2,4-ジフルオロベンジルアミノ)フェニル基、4-(3,4-ジフルオロベンジルアミノ)フェニル基、4-(3,5-ジフルオロ 15 ベンジルアミノ)フェニル基、4-(2-クロロベンジルアミノ)フェニル基、 4- (3-クロロベンジルアミノ) フェニル基、4- (4-クロロベンジルアミ ノ)フェニル基、4-(2-ブロモベンジルアミノ)フェニル基、4-(3-ブ ロモベンジルアミノ)フェニル基、4-(4-ブロモベンジルアミノ)フェニル 基、4-(2,3-ジクロロベンジルアミノ)フェニル基、4-(2,4-ジク 20 ロロベンジルアミノ)フェニル基、4ー(3、4ージクロロベンジルアミノ)フ エニル基、4-(3,5-ジクロロベンジルアミノ)フェニル基、4-(2-メ チルベンジルアミノ)フェニル基、4-(3-メチルベンジルアミノ)フェニル 基、4-(4-メチルベンジルアミノ)フェニル基、4-(2-エチルベンジル アミノ)フェニル基、4-(3-エチルベンジルアミノ)フェニル基、4-(4 エチルベンジルアミノ)フェニル基、4-(4-n-プロピルベンジルアミ ノ)フェニル基、4-(4-tert-ブチルベンジルアミノ)フェニル基、4 - (4-n-ブチルベンジルアミノ)フェニル基、4-(2-トリフルオロメチ ルベンジルアミノ)フェニル基、4-(3-トリフルオロメチルベンジルアミ

ノ)フェニル基、4-(4-トリフルオロメチルベンジルアミノ)フェニル基、 4-(2-ペンタフルオロエチルベンジルアミノ)フェニル基、4-(3-ペン タフルオロエチルベンジルアミノ)フェニル基、4-(2,3-ジメチルベンジ ルアミノ)フェニル基、4-(3,4,5-トリメチルベンジルアミノ)フェニ ル基、4-(4-ペンチルベンジルアミノ)フェニル基、4-(4-ヘキシルベ ンジルアミノ)フェニル基、4-(3-メトキシベンジルアミノ)フェニル基、 4-(3,5-ジメトキシベンジルアミノ)フェニル基、4-(2,4,6-ト リメトキシベンジルアミノ)フェニル基、4-(2-トリフルオロメトキシベン ジルアミノ)フェニル基、4-(3-トリフルオロメトキシベンジルアミノ)フ 10 ェニル基、4-(4-トリフルオロメトキシベンジルアミノ)フェニル基、4-(2-ペンタフルオロエトキシベンジルアミノ)フェニル基、4-(3-ペンタ フルオロエトキシベンジルアミノ)フェニル基、4-(4-ペンタフルオロエト キシベンジルアミノ)フェニル基、(フェネチルアミノ)フェニル基、4-(2 ーフルオロフェネチルアミノ)フェニル基、4-(3-フルオロフェネチルアミ 15 ノ)フェニル基、4-(4-フルオロフェネチルアミノ)フェニル基、4-(2, 3-ジフルオロフェネチルアミノ)フェニル基、4-(2,4-ジフルオロフェ ネチルアミノ)フェニル基、4-(3,4-ジフルオロフェネチルアミノ)フェ ニル基、4-(3,5-ジフルオロフェネチルアミノ)フェニル基、4-(2-クロロフェネチルアミノ)フェニル基、4-(3-クロロフェネチルアミノ)フ ェニル基、4-(4-クロロフェネチルアミノ)フェニル基、4-(2-ブロモ 20 フェネチルアミノ)フェニル基、4-(3-ブロモフェネチルアミノ)フェニル 基、4-(4-ブロモフェネチルアミノ)フェニル基、4-(2,3-ジクロロ フェネチルアミノ)フェニル基、4-(2,4-ジクロロフェネチルアミノ)フ ェニル基、4-(3, 4-ジクロロフェネチルアミノ)フェニル基、4-(3, 5-ジクロロフェネチルアミノ) フェニル基、4-(2-メチルフェネチルアミ 25 ノ)フェニル基、4-(3-メチルフェネチルアミノ)フェニル基、4-(4-メチルフェネチルアミノ)フェニル基、4-(4-エチルフェネチルアミノ)フ ェニル基、4-(4-プロピルフェネチルアミノ)フェニル基、4-(4-

tert-ブチルフェネチルアミノ)フェニル基、4-(2-トリフルオロメチ

ルフェネチルアミノ)フェニル基、4-(3-トリフルオロメチルフェネチルア ミノ)フェニル基、4-(4-トリフルオロメチルフェネチルアミノ)フェニル 基、4-(2-ペンタフルオロエチルフェネチルアミノ)フェニル基、4-(3 ーペンタフルオロエチルフェネチルアミノ)フェニル基、4-(2,3-ジメチ ルフェネチルアミノ)フェニル基、4-(2-トリフルオロメトキシフェネチル アミノ)フェニル基、4-(3-トリフルオロメトキシフェネチルアミノ)フェ ニル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェネチルアミノ)フェニル基、4-(2-ペンタフルオロエトキシフェネチルアミノ)フェニル基、4-(3-ペン タフルオロエトキシフェネチルアミノ)フェニル基、4-(4-ペンタフルオロ エトキシフェネチルアミノ)フェニル基、4-(3-フェニルプロピルアミノ) 10 フェニル基、4-[3-(2-フルオロフェニル)プロピルアミノ]フェニル基、 4-[3-(3-フルオロフェニル)プロピルアミノ]フェニル基、4-[3-(4-フルオロフェニル) プロピルアミノ] フェニル基、4-「3-(2.3-ジフルオロフェニル)プロピルアミノ]フェニル基、4-[3-(2,4-ジフ ルオロフェニル)プロピルアミノ]フェニル基、4-[3-(3,4-ジフルオ ロフェニル)プロピルアミノ]フェニル基、4-[3-(3,5-ジフルオロフ エニル)プロピルアミノ]フェニル基、4-[3-(2-クロロフェニル)プロ ピルアミノ]フェニル基、4-[3-(3-クロロフェニル)プロピルアミノ] フェニル基、4-[3-(4-クロロフェニル)プロピルアミノ]フェニル基、 4-[3-(2-ブロモフェニル) プロピルアミノ] フェニル基、4-[3-20 (3-ブロモフェニル)プロピルアミノ]フェニル基、4-[3-(4-ブロモ フェニル)プロピルアミノ]フェニル基、4-[3-(2,3-ジクロロフェニ ル)プロピルアミノ]フェニル基、4-[3-(2,4-ジクロロフェニル)プ ロピルアミノ]フェニル基、4-[3-(3,4-ジクロロフェニル)プロピル アミノ]フェニル基、4ー[3-(3,5-ジクロロフェニル)プロピルアミ 25 ノ] フェニル基、4-[3-(2-メチルフェニル) プロピルアミノ] フェニル 基、4-[3-(3-メチルフェニル)プロピルアミノ]フェニル基、4-[3 - (4-メチルフェニル)プロピルアミノ]フェニル基、4-[3-(2-エチ ルフェニル)プロピルアミノ]フェニル基、4-[3-(3-エチルフェニル)

プロピルアミノ]フェニル基、4-[3-(4-エチルフェニル)プロピルアミ ノ]フェニル基、4-[3-(4-プロピルフェニル)プロピルアミノ]フェニ ル基、4- [3- (4-tert-ブチルフェニル) プロピルアミノ] フェニル 基、4-「3-(4-ブチルフェニル)プロピルアミノ]フェニル基、4-[3 5 - (2-トリフルオロメチルフェニル)プロピルアミノ]フェニル基、4-[3 - トリフルオロメチルフェニル] プロピルアミノ] フェニル基、4-[3-(4 ートリフルオロメチルフェニル)プロピルアミノ]フェニル基、4-[3-(2 ーペンタフルオロエチルフェニル)プロピルアミノ]フェニル基、4-[3-(3-ペンタフルオロエチルフェニル)プロピルアミノ]フェニル基、4- [3 - - (2.3-ジメチルフェニル)プロピルアミノ] フェニル基、4-[3-(3, 10 4.5-トリメチルフェニル)プロピルアミノ]フェニル基、4-[3-(4-ペンチルフェニル) プロピルアミノ] フェニル基、4-[3-(4-ヘキシルフ ェニル)プロピルアミノ]フェニル基、4-[3-(2-トリフルオロメトキシ フェニル)プロピルアミノ]フェニル基、4-[3-トリフルオロメトキシフェ ニル]プロピルアミノ]フェニル基、4-[3-(4-トリフルオロメトキシフ 15 ェニル)プロピルアミノ]フェニル基、4-[3-(2-ペンタフルオロエトキ シフェニル)プロピルアミノ]フェニル基、4-[3-(3-ペンタフルオロエ トキシフェニル)プロピルアミノ]フェニル基、4-[3-(4-ペンタフルオ ロエトキシフェニル)プロピルアミノ]フェニル基、2-フェノキシフェニル基、 3-フェノキシフェニル基、4-フェノキシフェニル基、2-(2-クロロフェ 20 ノキシ)フェニル基、2-(3-クロロフェノキシ)フェニル基、2-(4-ク ロロフェノキシ)フェニル基、3-(2-クロロフェノキシ)フェニル基、3-(3-クロロフェノキシ)フェニル基、3-(4-クロロフェノキシ)フェニル 基、4-(2-クロロフェノキシ)フェニル基、4-(3-クロロフェノキシ) フェニル基、4-(4-クロロフェノキシ)フェニル基、3-(4-メチルフェ 25 ノキシ)フェニル基、2-(3,4-ジメチルフェノキシ)フェニル基、4-(2, 4, 6-トリメチルフェノキシ)フェニル基、2-(2-トリフルオロメ チルフェノキシ)フェニル基、2-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)フェ ニル基、2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、3-(2-ト

リフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、3-(3-トリフルオロメチルフェ ノキシ)フェニル基、3-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、 4-(2-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、4-(3-トリフルオ ロメチルフェノキシ)フェニル基、4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) フェニル基、3-(4-メトキシフェノキシ)フェニル基、2-(3,4-ジメ 5 トキシフェノキシ)フェニル基、4-(2,4,6-トリメトキシフェノキシ) フェニル基、2-(2-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、2-(3-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、2-(4-トリフルオロ メトキシフェノキシ)フェニル基、3-(2-トリフルオロメトキシフェノキ シ)フェニル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、3 10 - (4-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、4-(2-トリフルオ ロメトキシフェノキシ)フェニル基、4-(3-トリフルオロメトキシフェノキ シ)フェニル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、4 - ベンジルオキシフェニル基、4 - (2 - フェニルエトキシ)フェニル基、4 -(3-フェニルプロポキシ) フェニル基、4-(4-フェニルブトキシ) フェニ 15 ル基、4-(5-フェニルペントキシ)フェニル基、4-(6-フェニルヘキシ ルオキシ)フェニル基、4-(4-フルオロベンジルオキシ)フェニル基、4-(3-フルオロベンジルオキシ)フェニル基、4-(2-フルオロベンジルオキ シ)フェニル基、4-(4-クロロベンジルオキシ)フェニル基、4-(3-ク ロロベンジルオキシ)フェニル基、4-(2-クロロベンジルオキシ)フェニル 20 基、3-(4-メチルベンジルオキシ)フェニル基、2-(2,4-ジメチルベ ンジルオキシ)フェニル基、4-(2,4,6-トリメチルベンジルオキシ)フ エニル基、4-(2-トリフルオロメチルベンジルオキシ)フェニル基、4-(3-トリフルオロメチルベンジルオキシ)フェニル基、4-(4-トリフルオ ロメチルベンジルオキシ)フェニル基、3-(4-メトキシルベンジルオキシ) 25 フェニル基、2-(2,4-ジメトキシベンジルオキシ)フェニル基、4-(2, 4, 6-トリメトキシベンジルオキシ)フェニル基、4-(2-トリフルオロメ トキシベンジルオキシ)フェニル基、4-(3-トリフルオロメトキシベンジル オキシ)フェニル基、4-(4-トリフルオロメトキシベンジルオキシ)フェニ

ル基、4-(4-フルオロフェニルエトキシ)フェニル基、4-(3-フルオロ フェニルエトキシ)フェニル基、4-(2-フルオロフェニルエトキシ)フェニ ル基、4-(4-クロロフェニルエトキシ)フェニル基、4-(3-クロロフェ ニルエトキシ)フェニル基、4-(2-クロロフェニルエトキシ)フェニル基、 4- (2-トリフルオロメチルフェニルエトキシ) フェニル基、4- (3-トリ フルオロメチルフェニルエトキシ)フェニル基、4-(4-トリフルオロメチル フェニルエトキシ)フェニル基、4-(2-トリフルオロメトキシフェニルエト キシ)フェニル基、4-(3-トリフルオロメトキシフェニルエトキシ)フェニ ル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニルエトキシ)フェニル基、4-[3-(4-フルオロフェニル)プロポキシ]フェニル基、4-[3-(3-フ 10 ルオロフェニル)プロポキシ]フェニル基、4-[3-(2-フルオロフェニ ル)プロポキシ]フェニル基、4-[3-(2-トリフルオロメチルフェニル) プロポキシ]フェニル基、4-[3-(3-トリフルオロメチルフェニル)プロ ポキシ]フェニル基、4-[3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロポキ - シ] フェニル基、4-[3-(2-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシ] 15 フェニル基、4- [3-(3-トリフルオロメトキシフェニル) プロポキシ] フ ェニル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)プロポキシ]フェニル基、 4- [4-(3-トリフルオロメチルフェニル) ブトキシ] フェニル基、4-[5-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペントキシ]フェニル基、4-[4 - (4-トリフルオロメトキシフェニル) ペントキシ] フェニル基、4- [6-20 (3-トリフルオロメチルフェニル)へキシルオキシ] フェニル基、4- [6-(4-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシルオキシ] フェニル基、4- [6-(4-トリフルオロメトキシフェニル)へキシルオキシ] フェニル基、3-(ピ ペリジンー1-イル)フェニル基、2-(4-ベンジルアミノピペリジン-1-イル)フェニル基、2-(3-ベンジルアミノピペリジン-1-イル)フェニル 25 基、2-(4-ベンジルアミノピペリジン-1-イル)フェニル基、2-(4-ベンジルアミノピペリジン-1-イル)フェニル基、2-(4-ベンジルアミノ

ピペリジン-1-イル)フェニル基、2-[4-(4-クロロベンジル)アミノ

ピペリジン-1-イル]フェニル基、2-[2-(2,4-ジクロロベンジル)

アミノピペリジンー1ーイル]フェニル基、2-[4-(2,4,6-)]クロロベンジル)アミノピペリジンー1ーイル]フェニル基、2-[4-(4-)]ルベンジル)アミノピペリジンー1ーイル]フェニル基、2-[4-(2,4-)]ジメチルベンジル)アミノピペリジンー1ーイル]フェニル基、2-[4-(2,4-)]ジメチルベンジル)アミノピペリジン1ーイル]フェニル基、1ーインシステルベンジル)アミノピペリジン1ーイル]フェニル基、1ーインシステルベンジル)アミノピペリジン1ーイル]フェニル基、1

- 4, 6-トリメチルベンジル)アミノピペリジン-1-イル]フェニル基、2-[4-(4-トリフルオロメチルベンジル)アミノピペリジン-1-イル]フェニル基、2-[4-(2, 4-ジトリフルオロメチルベンジル)ピペリジン-1-イル]フェニル基、2-{4-[2, 4, 6-トリ(トリフルオロメチル)ベンジル]アミノピペリジン-1-イル}フェニル基、2-[4-(4-メトキシベンジ
- 10 ル)アミノピペリジン-1-イル]フェニル基、2-[4-(2,4-ジメトキシベンジル)アミノピペリジン-1-イル]フェニル基、2-[4-(2,4,6-トリメトキシベンジル)アミノピペリジン-1-イル]フェニル基、2-[4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)アミノピペリジン-1-イル]フェニル基、2-[4-(3,5-トリフルオロメトキシベンジル)アミノピペリジン-1-イル]フェニル基、2-[4-(3,5-トリフルオロメトキシベンジル)アミノピペリ
- 15 ジンー1ーイル]フェニル基、2ー{4ー[2、4、6ートリ(トリフルオロメトキシ)ベンジル]アミノピペリジンー1ーイル}フェニル基、4ー(4ーメチルアミノピペリジンー1ーイル)フェニル基、4ー(4ージメチルアミノピペリジンー1ーイル)フェニル基、4ー(4ーエチルアミノピペリジンー1ーイル)フェニル基、4ー(4ージエチルアミノピペリジンー1ーイル)フェニル基、4ー
- 20 (4-n-プロピルアミノピペリジン-1-イル)フェニル基、4-(4-(ジ n-プロピルアミノ)ピペリジン-1-イル基、4-(4-n-ブチルアミノピペリジン-1-イル)フェニル基、4-[4-(N-エチル-N-メチルアミノ)ピペリジン-1-イル]フェニル基、4-[4-(N-ベンジル-N-メチルアミノ)ピペリジン-1-イル]フェニル基、4-(4-n-ペンチルアミノ
- 25 ピペリジン-1-イル)フェニル基、4-(4-n-ヘキシルアミノピペリジン-1-イル)フェニル基等のフェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子;ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基;ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基;置換基としてC1~6アルキル基及びフェニルC1~6アルキル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換

C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基か らなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい] からなる群より選ばれる基を1~2個有することのあるアミノ基;フェノキシ基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アル キル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より 選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい];フェニルC 1~6アルコキシ基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは 未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキ シ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していても よい〕及びピペリジル基「ピペリジン環上には、少なくとも1個のアミノ基が置 10 換していてもよい。該アミノ基上には、フェニルC1~6アルキル基(フェニル 環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及び ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基 が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい。)及びC1~6アルキル 基なる群より選ばれる基が1~2個置換していてもよい]からなる群より選ばれ た基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい)を挙げることができ る。

ビフェニリルC1~6アルコキシ基としては、例えば、1,1'ービフェニル -4-イルメトキシ基、2-(1,1'ービフェニルー4-イル)エトキシ基、 20 3-(1,1'ービフェニルー4-イル)プロポキシ基、4-(1,1'ービフェニルー4-イル)ブトキシ基、5-(1,1'ービフェニルー4-イル)ペン チルオキシ基、6-(1,1'ービフェニルー4-イル)へキシルオキシ基等を 挙げることができる。

フェニル環上に少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよいフェニル 25 C3~6アルケニルオキシ基としては、例えば、3-フェニル-2-プロペニル オキシ基(慣用名:シンナミルオキシ基)、4-フェニル-2-ブテニルオキシ 基、4-フェニル-3-ブテニルオキシ基、3-(2-フルオロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(3-フルオロフェニル)-2-プロペニルオキシ 基、3-(4-フルオロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2、3-

ジフルオロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2,4-ジフルオロフ ェニル) -2-プロペニルオキシ基、3-(3,4-ジフルオロフェニル)-2 ープロペニルオキシ基、3-(3,5-ジフルオロフェニル)-2-プロペニル オキシ基、3-(2-クロロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(3-5 クロロフェニル)ー2ープロペニルオキシ基、3ー(4ークロロフェニル)ー2 ープロペニルオキシ基、3-(2,4,6-トリクロロフェニル)-2-プロペ $- \mu + \nu = 0$ $- \mu = 0$ ロペニルオキシ基、3- (2, 3-ジクロロフェニル) - 2-プロペニルオキシ 基、3-(2,4-ジクロロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(3, 10 4-ジクロロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(3,5-ジクロロフ ェニル) -2-プロペニルオキシ基、3-(2-ブロモフェニル) -2-プロペ ニルオキシ基、3-(3-ブロモフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(4-ブロモフェニル) -2-プロペニルオキシ基、4-(4-クロロフェニ ル) -3-ブテニルオキシ基、4-(2,3-ジクロロフェニル)-3-ブテニ 15 ルオキシ基、4-(2,4-ジクロロフェニル)-3-ブテニルオキシ基、4-(3, 4-ジクロロフェニル) -3-ブテニルオキシ基、4-(3, 5-ジクロ ロフェニル) -3-ブテニルオキシ基、5-(4-クロロフェニル) -4-ペン テニルオキシ基、5-(2、3-ジクロロフェニル)-4-ペンテニルオキシ基、 5-(2,4-ジクロロフェニル)-4-ペンテニルオキシ基、5-(3,4-20 ジクロロフェニル) -4-ペンテニルオキシ基、5-(3,5-ジクロロフェニ ル) - 4 - ペンテニルオキシ基、6 - (4 - クロロフェニル) - 5 - ヘキセニル オキシ基、6-(2,3-ジクロロフェニル)-5-ヘキセニルオキシ基、6-(2, 4ージクロロフェニル)-5-ヘキセニルオキシ基、6-(3, 4-ジク ロロフェニル) -5-ヘキセニルオキシ基、6-(3,5-ジクロロフェニル) 25 -5-ヘキセニルオキシ基等のフェニル環上にハロゲン原子が1~5個、好まし くは1~3個置換していてもよいフェニルC3~6アルケニルオキシ基を挙げる ことができる。

フェノキシ基(フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換も しくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6

アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよ い。)としては、例えば、フェノキシ基、2-フルオロフェノキシ基、3-フル オロフェノキシ基、4-フルオロフェノキシ基、2-クロロフェノキシ基、3-クロロフェノキシ基、4ークロロフェノキシ基、2ーブロモフェノキシ基、3ー 5 ブロモフェノキシ基、4ーブロモロフェノキシ基、2,3ージクロロフェノキシ 基、3、4ージクロロフェノキシ基、2、4ージクロロフェノキシ基、3、4、 5-トリクロロフェノキシ基、2,4,6-トリクロロフェノキシ基、2,3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェノキシ基、2-シアノフェノキシ基、3-シア ノフェノキシ基、4ーシアノロフェノキシ基、2ーメチルフェノキシ基、2,4, 6-トリシアノロフェノキシ基、2、3-ジシアノフェノキシ基、3-メチルフ 10 エノキシ基、4-メチルフェノキシ基、2-エチルフェノキシ基、3-エチルシ フェノキシ基、4ーエチルフェノキシ基、4-n-プロピルフェノキシ基、4tertーブチルフェノキシ基、4-n-ブチルフェノキシ基、2-トリフルオ ロメチルフェノキシ基、3-トリフルオロメチルフェノキシ基、4-トリフルオ ロメチルフェノキシ基、2-ペンタフルオロエチルフェノキシ基、3-ペンタフ ルオロエチルフェノキシ基、2、3-ジメチルフェノキシ基、3、4、5-トリ メチルフェノキシ基、4-n-ペンチルフェノキシ基、4-n-ヘキシルフェノ キシ基、2-メトキシフェノキシ基、3-メトキシフェノキシ基、4-メトキシ フェノキシ基、2-エトキシフェノキシ基、3-エトキシフェノキシ基、4-エ トキシフェノキシ基、4-n-プロポキシフェノキシ基、4-tert-ブトキ 20 シフェノキシ基、4-n-ブトキシフェノキシ基、2-トリフルオロメトキシフ エノキシ基、3-トリフルオロメトキシフェノキシ基、4-トリフルオロメトキ シフェノキシ基、2ーペンタフルオロエトキシフェノキシ基、3ーペンタフルオ ロエトキシフェノキシ基、2,3-ジメトキシフェノキシ基、3,4,5-トリ メトキシフェノキシ基、4-n-ペンチルオキシフェノキシ基、4-n-ヘキシ 25 ルオキシフェノキシ基等のフェノキシ基(フェニル環上には、ハロゲン原子、シ アノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換も しくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好

ましくは1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

フェニルC1~6アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン置換 もしくは未置換のC1~6アルコキシ基が少なくとも1個置換していてもよい) としては、例えば、ベンジルオキシカルボニル基、フェニルエトキシカルボニル 基、3-フェニルプロポキシカルボニル基、2-フェニルプロポキシカルボニル 5 基、4-フェニルブトキシカルボニル基、5-フェニルペントキシカルボニル基、 4-フェニルペントキシカルボニル基、6-フェニルヘキシルオキシカルボニル 基、2-メトキシベンジルオキシカルボニル基、2,4-ジメトキシベンジルオ キシカルボニル基、2, 4, 6-トリメトキシベンジルオキシカルボニル基、2 ートリフルオロメトキシベンジルオキカルボニル基、3-トリフルオロメトキシ ベンジルオキシカルボニル基、4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボ 10 ニル基、2-(2-トリフルオロメトキシフェニル)エトキシカルボニル基、2 - (3-トリフルオロメトキシフェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-ト リフルオロメトキシフェニル)エトキシカルボニル基、3-(3-トリフルオロ メトキシフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(4-トリフルオロメトキシ フェニル)プロポキシカルボニル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニ 15 ル)ペントキシカルボニル基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル)へキ シルオキシカルボニル基等のフェニルC1~6アルコキシカルボニル基(フェニ ル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基が1~3個置 換していてもよい)を挙げることができる。

 フェニル環上に少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよいフェニル C1~6アルキルカルバモイル基としては、例えば、ベンジルカルバモイル基、 2-フェネチルカルバモイル基、3-フェニルプロピルカルバモイル基、2-フェニルプロピルカルバモイル基、4-フェニルブチルカルバモイル基、5-フェニルペンチルカルバモイル基、6-フェニルペンチルカルバモイル基、6-フェニルペンチルカルバモイル基、2-フルオロベンジルカルバモイル基、3-フルオロベンジルカルバモイル基、2, 4, 6-トリクロロベンジルカルバモイル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジルカルバモイル基、4-フルオロベンジルカルバモイル基、2-クロロベンジルカルバモイル基、3-クロロベンジルカルバモイル基、3-クロロベンジルカルバモイル基、4-クロロベンジルカルバモイル基、2-ブロモベンジルカルバモイル基、4-クロロベンジルカルバモイル基、2-ブロモベンジルカ ルバモイル基、3ーブロモベンジルカルバモイル基、4ーブロモベンジルカルバモイル基、2ーヨードベンジルカルバモイル基、3ーヨードベンジルカルバモイル基、4ーヨードベンジルカルバモイル基、2,3ージフルオロベンジルカルバモイル基、3,4ージフルオロベンジルカルバモイル基、3,5ージフルオロベンジルカルバモイル基、2,6ージフルオロベンジルカルバモイル基、2,6ージフルオロベンジルカルバモイル基、3,4ージクロロベンジルカルバモイル基、3,5ージクロロベンジルカルバモイル基、3,4ージクロロベンジルカルバモイル基、3,5ージクロロベンジルカルバモイル基、2,4ージクロロベンジルカルバモイル基、2,6ージクロロベンジルカルバモイル基、2,6ージクロロベンジルカルバモイル基、2,6ージクロロベンジルカルバモイル基等のフェニル環上にハロゲン原子が1~5個置換していてもよいフェニルC1~6アルキルカルバモイルを挙げることができる。

フェニルチオ基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6 アルコキシ基が少なくとも1個置換していてもよい)としては、例えば、フェニルチオ基、2ーメトキシフェニルチオ基、3ーメトキシフェニルチオ基、4ーメトキシフェニルチオ基、2,4,6ートリトキシフェニルチオ基、3,5ージトリフルオロメトキシフェニルチオ基、2ートリフルオロメトキシフェニルチオ基、3ートリフルオロメトキシフェニルチオ基、2ートリフルオロメトキシフェニルチオ基、4ートリフルオロメトキシフェニルチオ基、4ーエトキシフェニルチオ基、4ーペンタフルオロエトキシフェニルチオ基、4ープロポキシフェニルチオ基、4ーブトキシフェニルチオ基、4ーペンチルオキシフェニルチオ基、4ーベキシルオキシフェニルチオ基(フェニルチオ基、4ーヘキシルオキシフェニルチオ基等のフェニルチオ基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基が1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

フェニルスルホキシド基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換の C1~6アルコキシ基が少なくとも1個置換していてもよい)としては、例えば、 25 フェニルスルホキシド基、2ーメトキシフェニルスルホキシド基、3ーメトキシ フェニルスルホキシド基、4ーメトキシフェニルスルホキシド基、2,4ージメ トキシフェニルスルホキシド基、2,4,6ートリメトキシフェニルスルホキシ ド基、3,5ージトリフルオロメトキシフェニルスルホキシド基、2ートリフル オロメトキシフェニルスルホキシド基、3ートリフルオロメトキシフェニルスル ホキシド基、4ートリフルオロメトキシフェニルスルホキシド基等のフェニルス ルホキシド基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アル コキシ基が1~3個置換してもよい)を挙げることができる。

ピリジルC1~6アルコキシ基としては、例えば、2-ピリジルメトキシ基、 3-ピリジルメトキシ基、4-ピリジルメトキシ基、2-(2-ピリジル) エトキシ基、2-(3-ピリジル) エトキシ基、2-(4-ピリジル) エトキシ基、3-(2-ピリジル) プロポキシ基、3-(3-ピリジル) プロポキシ基、3-(4-ピリジル) プロポキシ基、4-(3-ピリジル) プトキシ基、4-(3-ピリジル) ブトキシ基、4-(3-ピリジル) ブトキシ基、4-(2-ピリジル) ブトキシ基、5-(2-ピリジ 10 ル) ペンチルオキシ基、5-(3-ピリジル) ペンチルオキシ基、5-(4-ピリジル) ペンチルオキシ基、6-(3-ピリジル) ペキシルオキシ基、6-(3-ピリジル) ヘキシルオキシ基等を挙げることができる。

フェニル環上に少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよいフェニル C2~6アルカノイル基としては、例えば、フェニルアセチル基、3-フェニル 15 プロピオニル基、4ーフェニルブチリル基、5-フェニルペンタノイル基、6-フェニルヘキサノイル基、2ーフルオロフェニルアセチル基、3ーフルオロフェ ニルアセチル基、4-フルオロフェニルアセチル基、2-クロロフェニルアセチ ル基、3ークロロフェニルアセチル基、4ークロロフェニルアセチル基、2ーブ 20 ロモフェニルアセチル基、3ーブロモフェニルアセチル基、4ーブロモフェニル アセチル基、2,3-ジクロロフェニルアセチル基、2,4,6-トリクロロフ エニルアセチル基、2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニルアセチル基、 3-(2-フルオロフェニル)プロピオニル基、3-(3-フルオロフェニル) プロピオニル基、3-(4-フルオロフェニル)プロピオニル基、3-(2-ク ロロフェニル)プロピオニル基、3-(3-クロロフェニル)プロピオニル基、 3-(4-クロロフェニル)プロピオニル基、3-(2-ブロモフェニル)プロ ピオニル基、3-(3-ブロモフェニル)プロピオニル基、3-(4-ブロモフ エニル)プロピオニル基、4-(4-フルオロフェニル)ブチリル基、4-(3 ークロロフェニル)ブチリル基、4-(4-クロロフェニル)ブチリル基、5-

(4-フルオロフェニル) ペンタノイル基、5- (3-クロロフェニル) ペンタ ノイル基、5-(4-クロロフェニル)ペンタノイル基、6-(4-フルオロフ ェニル) ヘキサノイル基、5-(3-クロロフェニル) ヘキサノイル基、6-(4-クロロフェニル) ヘキサノイル基等のフェニル環上にハロゲン原子が1~ 5 5個置換していてもよいフェニルC2~6アルカノイル基を挙げることができる。 フェニルカルバモイル基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換の C1~6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい)としては、例えば、 フェニルカルバモイル基、2-メチルフェニルカルバモイル基、3-メチルフェ ニルカルバモイル基、4ーメチルフェニルカルバモイル基、3,4ージメチルフ ェニルカルバモイル基、2,4,6-トリメチルフェニルカルバモイル基、4-10 n-プロピルフェニルカルバモイル基、4-n-ブチルフェニルカルバモイル基、 3-n-ペンチルフェニルカルバモイル基、2-n-ヘキシルフェニルカルバモ イル基、2-トリフルオロメチルフェニルカルバモイル基、3-トリフルオロメ チルフェニルカルバモイル基、4-トリフルオロメチルフェニルカルバモイル基、 15 N-メチル-N-フェニルカルバモイル基、N-(2-メチルフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(3-エチルフェニル)-N-メチルカルバモイル 基、N-(4-n-ヘキシルフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(2 ーイソプロピルフェニル) -N-メチルカルバモイル基、N-(3-n-ブチル フェニル) - N - メチルカルバモイル基、N - (4 - t e r t - ブチルフェニ ル)-N-メチルカルバモイル基、N-(4-n-ペンチルフェニル)-N-メ 20 チルカルバモイル基、NーベンジルーN-フェニルカルバモイル基、N-ベンジ ル-N-(2-トリフルオロメチルフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N- (2, 3-ジメチルフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N- (2, 4,6-トリメチルフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3,5-ジトリフルオロメチルフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3-メ 25チルフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(4-tert-ブチルフ エニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-イソプロピルフェニル) カ ルバモイル基、NーベンジルーNー(3-n-プロピルフェニル)カルバモイル

基、N-ベンジル-N-(4-エチルフェニル)カルバモイル基等のフェニルカ

ルバモイル基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基 $1\sim3$ 個が置換していてもよい。また、カルバモイル基のアミノ基部分は、 $C1\sim6$ アルキル基又はフェニル $C1\sim6$ アルキル基が置換していてもよい)を挙げることができる。

- 5 ピペリジニルオキシカルボニル基(ピペリジン環上には、置換基としてフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1 ~ 6 アルキル基が少なくとも 1 個置換していてもよい。)としては、例えば、ピペリジンー 1 ーイルオキシカルボニル基、ピペリジンー 2 ーイルオキシカルボニル基、ピペリジンー 3 ーイルオキシカルボニル基、ピペリジ
- 10 ン-4-イルオキシカルボニル基、1-フェニルピペリジン-4-イルオキシカルボニル基、1,2-ジフェニルピペリジン-4-イルオキシカルボニル基、1,3,4-トリフェニルピペリジン-4-イルオキシカルボニル基、1-(2-メチルフェニル)ピペリジン-4-イルオキシカルボニル基、1-(3-メチルフェニル)ピペリジン-4-イルオキシカルボニル基、1-(4-メチルフェニ
- 15 ル) ピペリジンー4ーイルオキシカルボニル基、1ー(2,4ージメチルフェニル) ピペリジンー4ーイルオキシカルボニル基、1ー(2,4,6ートリメチルフェニル) ピペリジンー4ーイルオキシカルボニル基、1ー(2ートリフルオロメチルフェニル) ピペリジンー4ーイルオキシカルボニル基、1ー(3ートリフルオロメチルフェニル) ピペリジンー4ーイルオキシカルボニル基、1ー(3,
- 20 5-ジトリフルオロメチルフェニル)ピペリジン-4-イルオキシカルボニル基、 1-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペリジン-4-イルオキシカルボニル基、1-(2-ペンタフルオロエチルフェニル)ピペリジン-4-イルオキシカルボニル基、1-(3-ペンタフルオロエチルフェニル)ピペリジン-4-イルオキシカルボニル基、1-(4-ペンタフルオロエチルフェニル)ピペリジン
- 25 -4-イルオキシカルボニル基、1-(2-n-プロピルフェニル) ピペリジン -4-イルオキシカルボニル基、1-(3-n-プロピルフェニル) ピペリジン -4-イルオキシカルボニル基、1-(4-n-プロピルフェニル) ピペリジン -4-イルオキシカルボニル基等のピペリジニルオキシカルボニル基(ピペリジン ン環上には、置換基としてフェニル基[フェニル環上には、ハロゲン置換もしく

ができる。

は未置換 $C1\sim6$ アルキル基が $1\sim3$ 個置換していてもよい]が $1\sim3$ 個置換していてもよい。)を挙げることができる。

R²⁴及びR²⁵が、隣接する窒素を介して形成する5~6員環の飽和複素環とは、隣接する窒素原子と共に、窒素原子、酸素原子もしくは硫黄原子を介し又 は介することなく互いに結合して形成する複素環であり、例えば、ピロリジニル 基、ピペラジル基、ピペリジル基、モルホリノ基、チオモルホリノ基等を挙げることができる。

C3~8のシクロアルキルC1~6アルキル基としては、例えば、シクロプロ

ピルメチル基、2-シクロプロピルエチル基、3-シクロプロピルプロピル基、
4-シクロプロピルブチル基、4-シクロプロピルペンチル基、6-シクロプロピルへキシル基、シクロブチルメチル基、2-シクロブチルエチル基、3-シクロブチルプロピル基、4-シクロブチルプチル基、4-シクロブチルペンチル基、6-シクロブチルへキシル基、シクロペンチルメチル基、2-シクロペンチルエチル基、3-シクロペンチルプロピル基、4-シクロペンチルブチル基、4-シクロペンチルペンチル基、6-シクロペンチルでシールを、シクロへキシルメチル基、2-シクロへキシルエチル基、3-シクロへキシルプロピル基、4-シクロへキシルブチル基、4-シクロへキシルブチル基、4-シクロへキシルでチルメチル基、シクロへプチルメチル基、2-シクロへプチルメチル基、3-シクロへプチルアロピル基、4-シクロへプチルアリロピル基、4-シクロへプチルアチルターのプチルスチルを、4-シクロへプチルペンチルを、4-シクロへプチルペンチルを、4-シクロへプチルペンチルを、4-シクロへプチルペンチルを、4-シクロへプチルペンチルを、4-シクロへプチルペンチルを、4-シクロへプチルへキシル基、シクロオクチルメチル基、2-シクロオク

フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子;シアノ基; ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基; C3~8シクロアルキル 基; ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基; 置換基としてC1~6アルキル基を有することのあるアミノ基; C1~6アルコキシカルボニル基; フェノキシ基; フェニルC1~6アルキル基; フェニルC2~6アルケニル基; ピリジル基; イミダゾリル基及びピペリジル基からなる群より選ばれた基が1~

チルエチル基、3-シクロオクチルプロピル基、4-シクロオクチルブチル基、

4-シクロオクチルペンチル基、6-シクロオクチルヘキシル基等を挙げること

3個置換していてもよい)としては、例えば、ベンジル基、1-フェネチル基、 2-フェネチル基、3-フェニルプロピル基、2-フェニルプロピル基、4-フ ェニルブチル基、5-フェニルペンチル基、4-フェニルペンチル基、6-フェ ニルヘキシル基、4-シアノベンジル基、2、3-ジシアノベンジル基、2、4、 6-トリシアノベンジル基、2-(4-シアノフェニル)エチル基、3-(4-5 シアノフェニル)プロピル基、2-(4-シアノフェニル)プロピル基、4-(4-シアノフェニル)ブチル基、5-(4-シアノフェニル)ペンチル基、4 - (4-シアノフェニル)ペンチル基、6-(4-シアノフェニル)へキシル基、 2-シアノベンジル基、2-(3-シアノフェニル)エチル基、3-(2-シア ノフェニル)プロピル基、2- (2-シアノフェニル)プロピル基、4- (3-10 シアノフェニル) ブチル基、5-(2-シアノフェニル) ペンチル基、4-(3 ーシアノフェニル)ペンチル基、6-(3-シアノフェニル)へキシル基、2-フルオロベンジル基、3-フルオロベンジル基、4-フルオロベンジル基、2-クロロベンジル基、3-クロロベンジル基、4-クロロベンジル基、2-ブロモ ベンジル基、3-ブロモベンジル基、4-ブロモベンジル基、2-ヨードベンジ 15 ル基、3-ヨードベンジル基、4-ヨードベンジル基、2,3-ジフルオロベン ジル基、3,4-ジフルオロベンジル基、3,5-ジフルオロベンジル基、2, 4-ジフルオロベンジル基、2、6-ジフルオロベンジル基、2、3-ジクロロ ベンジル基、3,4ージクロロベンジル基、3,5ージクロロベンジル基、2, 4,6ートリクロロベンジル基、2,4ージクロロベンジル基、2,6ージクロ 20 ロベンジル基、2-トリフルオロメチルベンジル基、2-メチルベンジル基、2, 4-ジメチルベンジル基、2,4,6-トリメチルベンジル基、3,5-ジトリ フルオロメチルベンジル基、3-トリフルオロメチルベンジル基、4-トリフル オロメチルベンジル基、2-ペンタフルオロエチルベンジル基、3-ペンタフル オロエチルベンジル基、4ーペンタフルオロエチルベンジル基、2ートリフルオ 25 ロメトキシベンジル基、3-トリフルオロメトキシベンジル基、4-トリフルオ ロメトキシベンジル基、2-ペンタフルオロエトキシベンジル基、3-ペンタフ ルオロエトキシベンジル基、4-ペンタフルオロエトキシベンジル基、2-(2 ートリフルオロメチルフェニル) エチル基、2-(3-トリフルオロメチルフェ

ニル)エチル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-メト キシベンジル基、2,4-ジメトキシベンジル基、2,4,6-トリメトキシベ ンジル基、3、5ージトリフルオロメトキシベンジル基、2ークロロー4ートリ フルオロメチルベンジル基、3-フルオロー4-トリクロロメトキシベンジル基、 2-(2-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、2-(3-トリフルオロ メトキシフェニル) エチル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニル) エチ ル基、2-(2-ペンタフルオロエトキシフェニル) エチル基、2-(3-ペン タフルオロエトキシフェニル) エチル基、2-(4-ペンタフルオロエトキシフ ェニル) エチル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル) プロピル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(4-トリフルオロメチ 10 ルフェニル)プロピル基、3-(2-トリフルオロメトキシフェニル)プロピル 基、3-(3-トリフルオロメトキシフェニル)プロピル基、3-(4-トリフ ルオロメトキシフェニル)プロピル基、3-(3-ペンタフルオロエトキシフェ ニル)プロピル基、3-(4ーペンタフルオロエトキシフェニル)プロピル基、 4-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)ブチル基、5-(4ートリフルオ 15 ロメチルフェニル)ペンチル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペン チル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ペンチル基、6-(3-ト リフルオロメチルフェニル)ヘキシル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニ ル) ヘキシル基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ヘキシル基、2-シクロヘキシルベンジル基、3-シクロヘキシルベンジル基、4-シクロヘキシ 20 ルベンジル基、2-(2-シクロヘキシルフェニル) エチル基、2-(3-シク ロヘキシルフェニル) エチル基、2-(4-シクロヘキシルフェニル) エチル基、 3-(2-シクロヘキシルフェニル)プロピル基、3-(3-シクロヘキシルフ ェニル)プロピル基、3-(4-シクロヘキシルフェニル)プロピル基、3-ア ミノベンジル基、2、4ージアミノベンジル基、2、4、6ートリアミノベンジ 25 ル基、2-ジメチルアミノベンジル基、3-ジメチルアミノベンジル基、4-ジ メチルアミノベンジル基、2-(2-ジメチルアミノフェニル)エチル基、2-(3-ジメチルアミノフェニル) エチル基、2-(4-ジメチルアミノフェニ ル) エチル基、3-(2-ジメチルアミノフェニル) プロピル基、3-(3-ジ

メチルアミノフェニル)プロピル基、3-(4-ジメチルアミノフェニル)プロ ピル基、2-メトキシカルボニルベンジル基、3-メトキシカルボニルベンジル 基、4ーメトキシカルボニルベンジル基、2-(2ーメトキシカルボニルフェニ ル) エチル基、2-(3-メトキシカルボニルフェニル) エチル基、2-(4-メトキシカルボニルフェニル) エチル基、3-(2-メトキシカルボニルフェニ ル)プロピル基、3-(3-メトキシカルボニルフェニル)プロピル基、3-(4-メトキシカルボニルフェニル) プロピル基、2-エトキシカルボニルベン ジル基、3-エトキシカルボニルベンジル基、4-エトキシカルボニルベンジル 基、2-(2-エトキシカルボニルフェニル)エチル基、2-(3-エトキシカ ルボニルフェニル) エチル基、2-(4-エトキシカルボニルフェニル) エチル 10 基、3-(2-エトキシカルボニルフェニル)プロピル基、3-(3-エトキシ カルボニルフェニル)プロピル基、3-(4-エトキシカルボニルフェニル)プ ロピル基、2-フェノキシベンジル基、3-フェノキシベンジル基、4-フェノ キシベンジル基、2-スチリルベンジル基、3-スチリルベンジル基、4-スチ リルベンジル基、2-(2-フェノキシフェニル)エチル基、2-(3-フェノ 15 キシフェニル) エチル基、2-(4-フェノキシフェニル) エチル基、3-(2 ーフェノキシフェニル) プロピル基、3- (3-フェノキシフェニル) プロピル 基、3-(4-フェノキシフェニル)プロピル基、2-ベンジルベンジル基、3 ーベンジルベンジル基、4ーベンジルベンジル基、2-(2ーベンジルフェニ ル)エチル基、2-(3-ベンジルフェニル)エチル基、2-(4-ベンジルフ 20 ェニル) エチル基、3-(2-ベンジルフェニル) プロピル基、3-(3-ベン ジルフェニル)プロピル基、3-(4-ベンジルフェニル)プロピル基、2-(2-フェネチル) ベンジル基、3-(2-フェネチル) ベンジル基、4-(2 ーフェネチル) ベンジル基、2-(2-(1-フェネチル) フェニル) エチル基、 2- (3- (2-フェネチル) フェニル) エチル基、2- (4- (2-フェネチ 25 ル)フェニル)エチル基、2-(3-(2-フェネチル)フェニル)プロピル基、 3- (2- (2-フェネチル) フェニル) プロピル基、3- (4- (1-フェネ チル)フェニル)プロピル基、2-(3-ピリジル)ベンジル基、3-(3-ピ リジル) ベンジル基、4-(3-ピリジル) ベンジル基、2-(1-イミダゾリ

ル)ベンジル基、3-(1-イミダゾリル)ベンジル基、4-(1-イミダゾリル)ベンジル基、2-(1-ピペリジノ)ベンジル基、3-(1-ピペリジノ)
 ベンジル基、4-(1-ピペリジノ)ベンジル基等を挙げることができる。

ベンジル基、4-(1-ピペリジノ)ベンジル基等を挙げることができる。 ビフェニリルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲ ン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基及び置換基としてC1~6アルキル基を有することのあるア ミノ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)とし ては、例えば、2-ビフェニリルメチル基、3-ビフェニリルメチル基、4-ビ フェニリルメチル基、2-(2-ビフェニリル)エチル基、2-(3-ビフェニ リル) エチル基、2-(4-ビフェニリル) エチル基、3-(2-ビフェニリ ル)プロピル基、3-(3-ビフェニリル)プロピル基、3-(4-ビフェニリ ル)プロピル基、4-(4-ビフェニリル)ブチル基、5-(4-ビフェニリ ル)ペンチル基、6-(4-ビフェニリル)へキシル基、2'-フルオロ-2-ビフェニリルメチル基、2'-フルオロ-3-ビフェニリルメチル基、2'-フ 15 ルオロー4ービフェニリルメチル基、3'ーフルオロー2ービフェニリルメチル 基、3、一フルオロー3-ビフェニリルメチル基、3、一フルオロー4-ビフェ ニリルメチル基、4'-フルオロ-2-ビフェニリルメチル基、4'-フルオロ -3-ビフェニリルメチル基、4'-フルオロー4-ビフェニリルメチル基、 2, -クロロー2ービフェニリルメチル基、2, -クロロー3ービフェニリルメ チル基、2'ークロロー4ービフェニリルメチル基、3'ークロロー2ービフェ 20 ニリルメチル基、3'-クロロー3ービフェニリルメチル基、3'-クロロー4 ービフェニリルメチル基、4'ークロロー2ービフェニリルメチル基、4'ーク ロロー3ービフェニリルメチル基、4'ークロロー4ービフェニリルメチル基、 2', 4'ージクロロー4ービフェニリルメチル基、2', 4', 6'ートリク ロロー3-ビフェニリルメチル基、3′,5′-ジトリフルオロメチルー4-ビ 25 フェニリルメチル基、2′,3′,4′,5′,6′ーペンタフルオロー3ービ フェニリルメチル基、2'ーメチルー2ービフェニリルメチル基、2'ーメチル -3-ビフェニリルメチル基、2'-メチル-4-ビフェニリルメチル基、3'

-メチル-2-ビフェニリルメチル基、3, -メチル-3-ビフェニリルメチル

基、3'ーメチルー4ービフェニリルメチル基、4'ーメチルー2ービフェニリ ルメチル基、4'ーメチルー3ービフェニリルメチル基、4'ーメチルー4ービ フェニリルメチル基、2'ートリフルオロメチルー2ービフェニリルメチル基、 2'ートリフルオロメチルー3ービフェニリルメチル基、2'ートリフルオロメ チルー4ービフェニリルメチル基、3'ートリフルオロメチルー2ービフェニリ ルメチル基、3'ートリフルオロメチル-3-ビフェニリルメチル基、3'-ト リフルオロメチルー4ービフェニリルメチル基、4'ートリフルオロメチルー2 - ビフェニリルメチル基、4'-トリフルオロメチル-3-ビフェニリルメチル 基、4'ートリフルオロメチルー4ービフェニリルメチル基、2'ーメトキシー 2-ビフェニリルメチル基、2'-メトキシ-3-ビフェニリルメチル基、2' 10 ーメトキシー4ービフェニリルメチル基、3'ーメトキシー2ービフェニリルメ チル基、3'ーメトキシー3ービフェニリルメチル基、2',4'ージメトキシ - 3 - ビフェニリルメチル基、2′, 4′, 6′-トリメトキシ-4 - ビフェニ リルメチル基、2'ーメトキシー4'ートリフルオロメチルー2ービフェニリル メチル基、3'ーメチルー4'ートリフルオロメトキシー2ービフェニリルメチ ル基、2'-クロロー4'-トリフルオロメトキシー3-ビフェニリルメチル基、 3'ーメトキシー4ービフェニリルメチル基、4'ーメトキシー2ービフェニリ ルメチル基、4'ーメトキシー3ービフェニリルメチル基、4'ーメトキシー4 ービフェニリルメチル基、2'ートリフルオロメトキシー2ービフェニリルメチ ル基、2'ートリフルオロメトキシー3ービフェニリルメチル基、2'ートリフ ルオロメトキシー4ービフェニリルメチル基、3 1ートリフルオロメトキシー2 -ビフェニリルメチル基、3, -トリフルオロメトキシ-3-ビフェニリルメチ ル基、3'ートリフルオロメトキシー4ービフェニリルメチル基、4'ートリフ ルオロメトキシー2-ビフェニリルメチル基、4, ートリフルオロメトキシー3 - ビフェニリルメチル基、4'-トリフルオロメトキシ-4-ビフェニリルメチ 25ル基、2-(4'-トリフルオロメトキシ-4-ビフェニリル)エチル基、3-(4'ートリフルオロメトキシー4ービフェニリル)プロピル基、3-(4'-トリフルオロメトキシー4ービフェニリル)プロピル基、4ー(4'ートリフル オロメトキシー4ービフェニリル)ブチル基、5-(4'-トリフルオロメトキ

シー4ービフェニリル)ペンチル基、6ー(4, ートリフルオロメトキシー4ービフェニリル)へキシル基、4, ージメチルアミノー3ービフェニリルメチル基、4, ージメチルアミノー4ービフェニリルメチル基等のビフェニリルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基及び置換基としてC1~6アルキル基を1~2個有することのあるアミノ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

ナフチルC1~6アルキル基としては、例えば、1ーナフチルメチル基、2-10 ナフチルメチル基、2-(1ーナフチル) エチル基、1-(2ーナフチル) エチル基、3-(1ーナフチル) プロピル基、3-(2ーナフチル) プロピル基、4-(1ーナフチル) ブチル基、4-(2ーナフチル) ブチル基、5-(1ーナフチル) ペンチル基、5-(1ーナフチル) ペンチル基、6-(1ーナフチル) ヘキシル基、6-(2ーナフチル) ヘキシル基等を挙げることができる。

フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子;シアノ基;置換基としてC1 15 ~6アルキル基を有することのあるアミノ基;ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基;ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基;C1 ~6アルコキシカルボニル基;カルボキシル基;フェノキシ基[フェニル環上に は、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲ ン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少な 20くとも1種が置換していてもよい];アミノC1~6アルキル基[アミノ基上に はフェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基か らなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)及びC1~6 アルキル基からなる群より選ばれた基を少なくとも1種が置換していてもよい] 25 及びフェニル $C1\sim6$ アルコキシ基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲ ン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していて もよい]からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)と

しては、例えば、フェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル 基、4ーフルオロフェニル基、2ークロロフェニル基、3ークロロフェニル基、 4ークロロフェニル基、2ーブロモフェニル基、3ーブロモフェニル基、4ーブ ロモフェニル基、2-ヨードフェニル基、3-ヨードフェニル基、4-ヨードフ エニル基、2,3-ジフルオロフェニル基、3,4-ジフルオロフェニル基、3, 5-ジフルオロフェニル基、2,4-ジフルオロフェニル基、2,6-ジフルオ ロフェニル基、2,3ージクロロフェニル基、3,4ージクロロフェニル基、3, 5 - ジクロロフェニル基、2,4 - ジクロロフェニル基、2,6 - ジクロロフェ ニル基、3,4,5ートリフルオロフェニル基、2,3,4,5,6ーペンタフ ルオロフェニル基、3, 4, 5ートリクロロフェニル基、2, 4, 6ートリフル 10 オロフェニル基、2,4,6ートリクロロフェニル基、2ーシアノフェニル基、 3-シアノフェニル基、4-シアノフェニル基、2,4-ジシアノフェニル基、 2, 4, 6-トリシアノフェニル基、2-メチルフェニル基、3-メチルフェニ ル基、4ーメチルフェニル基、2、3ージメチルフェニル基、2、4、6ートリ メチルフェニル基、2-メチル-3-クロロフェニル基、3-メチル-4-クロ 15 ロフェニル基、2-クロロー4-メチルフェニル基、2-メチル-3-フルオロ フェニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、3-トリフルオロメチルフェ ニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、2-ペンタフルオロエチルフェニ ル基、3-ペンタフルオロエチルフェニル基、4-ペンタフルオロエチルフェニ 20 ル基、2-イソプロピルフェニル基、3-イソプロピルフェニル基、4-イソプ ロピルフェニル基、2-tert-ブチルフェニル基、3-tert-ブチルフ エニル基、4-tertーブチルフェニル基、2-secーブチルフェニル基、 3-sec-ブチルフェニル基、4-sec-ブチルフェニル基、2-n-ヘプ タフルオロプロピルフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、 4-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-ペンチルフェニル基、4-ヘ 25キシルフェニル基、2-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、4-メ トキシフェニル基、2, 4ージメトキシフェニル基、2, 4, 6ートリメトキシ フェニル基、2ーメトキシー3ークロロフェニル基、2ーフルオロー3ーメトキ シフェニル基、2-フルオロー4-メトキシフェニル基、2,6-ジメトキシフ

エニル基、2,3,4-トリフルオロフェニル基、2-トリフルオロメトキシフ エニル基、3-トリフルオロメトキシフェニル基、4-トリフルオロメトキシフ エニル基、2-ペンタフルオロエトキシフェニル基、3-ペンタフルオロエトキ シフェニル基、4-ペンタフルオロエトキシフェニル基、2-イソプロポキシフ エニル基、3-イソプロポキシフェニル基、4-イソプロポキシフェニル基、2 5 -tert-ブトキシフェニル基、3-tert-ブトキシフェニル基、4tertーブトキシフェニル基、2-sec-ブトキシフェニル基、3-sec ーブトキシフェニル基、4-sec-ブトキシフェニル基、2-n-ヘプタフル オロプロポキシフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4 -n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-ペンチルオキシフェニル基、 10 4-ヘキシルオキシフェニル基、3-アミノフェニル基、4-メチルアミノフェ ニル基、2-ジメチルアミノフェニル基、3-ジメチルアミノフェニル基、4-ジメチルアミノフェニル基、2-メトキシカルボニルフェニル基、3-メトキシ カルボニルフェニル基、4ーメトキシカルボニルフェニル基、2ーカルボキシフ エニル基、3-カルボキシフェニル基、4-カルボキシフェニル基、2,3-ジ 15 カルボキシフェニル基、2、4、6-トリカルボキシフェニル基、2-エトキシ カルボニルフェニル基、3-エトキシカルボニルフェニル基、4-エトキシカル ボニルフェニル基、2、3-ジエトキシカルボニルフェニル基、2、4、6-ト リメトキシカルボニルフェニル基、2-フェノキシフェニル基、3-フェノキシ フェニル基、4-フェノキシフェニル基、2-(2-クロロフェノキシ)フェニ 20ル基、2-(3-クロロフェノキシ)フェニル基、2-(4-クロロフェノキ シ)フェニル基、3-(2-クロロフェノキシ)フェニル基、3-(3-クロロ フェノキシ)フェニル基、3-(4-クロロフェノキシ)フェニル基、4-(2 ークロロフェノキシ)フェニル基、4-(3-クロロフェノキシ)フェニル基、 4-(4-クロロフェノキシ)フェニル基、2-(2-トリフルオロメチルフェ 25 ノキシ)フェニル基、2-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、 2-(3-メチルフェノキシ)フェニル基、2-(2, 3-ジメチルフェノキ シ)フェニル基、2-(3,4,5-トリメチルフェノキシ)フェニル基、2-

(4-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、3-(2-トリフルオロメ

チルフェノキシ)フェニル基、3-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)フェ ニル基、3-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、4-(2-ト リフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、4-(3-トリフルオロメチルフェ ノキシ)フェニル基、4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、 2-(3-メトキシフェノキシ)フェニル基、2-(2,3-ジメトキシフェノ キシ)フェニル基、2-(3,4,5-トリメトキシフェノキシ)フェニル基、 2- (2-トリフルオロメトキシフェノキシ) フェニル基、2- (3-トリフル オロメトキシフェノキシ)フェニル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェノ キシ)フェニル基、3-(2-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、 3- (3-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、3- (4-トリフル 10 オロメトキシフェノキシ)フェニル基、4-(2-トリフルオロメトキシフェノ キシ)フェニル基、4-(3-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、 4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、4-アミノメチルフ エニル基、4-メチルアミノメチルフェニル基、4-ジメチルアミノメチルフェ ニル基、4-ジエチルアミノメチルフェニル基、4-ジ(n-プロピル)アミノ 15 メチルフェニル基、4-(フェニルアミノメチル)フェニル基、4-(2-フェ ニルアミノエチル)フェニル基、4-(3-フェニルアミノプロピル)フェニル 基、4-(N-メチル-N-フェニルアミノメチル)フェニル基、4-(2-N -メチル-N-フェニルアミノエチル)フェニル基、4-(3-N-エチル-N ーフェニルアミノプロピル)フェニル基、4-(4-クロロフェニルアミノメチ 20 ル)フェニル基、4-[2-(4-クロロフェニルアミノ)エチル]フェニル基、 4- [3-(4-クロロフェニルアミノ)プロピル]フェニル基、4- [N-メ チルーN-4-クロロフェニルアミノ] メチル] フェニル基、4- [2- (N-メチル-N-4-クロロフェニルアミノ) エチル] フェニル基、4- [3- (N ーエチルーN-4-クロロフェニルアミノ)プロピル]フェニル基、4-(4-25トリフルオロメチルフェニルアミノメチル)フェニル基、4-[2-(4-トリ フルオロメチルフェニルアミノ) エチル] フェニル基、4-[2-(4-メチル フェニルアミノ) メチル] フェニル基、4-[2-(2, 4-ジメチルフェニル

アミノ) メチル] フェニル基、4-[2-(2,4,6-トリメチルフェニルア

ミノ) メチル] フェニル基、4-[3-(3,5-ジトリフルオロメチルフェニ ルアミノ)プロピル]フェニル基、4-[N-メチル-N-4-トリフルオロメ チルフェニルアミノ]メチル]フェニル基、4-[2-(N-メチル-N-4-トリフルオロメチルフェニルアミノ) エチル] フェニル基、4-「3-(N-エ - チル-N-4-トリフルオロメチルフェニルアミノ)プロピル] フェニル基、4 - [2-(3-メトキシフェニルアミノ) メチル] フェニル基、4-[2-(2, 4-ジメトキシフェニルアミノ) メチル] フェニル基、4-[2-(2, 4, 6 ートリメトキシフェニルアミノ)メチル]フェニル基、4-(4-トリフルオロ メトキシフェニルアミノメチル)フェニル基、4-[2-(3,5-ジトリフル 10 オロメトキシフェニルアミノ) エチル] フェニル基、4-[3-(4-トリフル オロメトキシフェニルアミノ) プロピル] フェニル基、4- [N-メチル-N-4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ]メチル]フェニル基、4-[2-(N-メチル-N-4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ) エチル] フェニ ル基、4-「3-(N-エチル-N-4-トリフルオロメトキシフェニルアミ ノ)プロピル]フェニル基、4ーベンジルオキシフェニル基、4ー(4ークロロ 15 ベンジルオキシ)フェニル基、4-[2-(2,3-ジクロロフェニル)エトキ シ] フェニル基、4-[3-(4-クロロフェニル) プロポキシ] フェニル基、 4- [4-(2, 4, 6-トリクロロフェニル) ブトキシ] フェニル基、4-(4-メチルベンジルオキシ)フェニル基、4-(3,4-ジメチルベンジルオ キシ)フェニル基、4-(2,4,6-トリメチルベンジルオキシ)フェニル基、 20 4- (4-トリフルオロメチルベンジルオキシ)フェニル基、4- [2-(4-トリフルオロメチルフェニル) エトキシ] フェニル基、4-[3-(4-トリフ ルオロメチルフェニル)プロポキシ]フェニル基、4-[4-(4-トリフルオ ロメチルフェニル) ブトキシ] フェニル基、4-(4-トリフルオロメトキシベ ンジルオキシ)フェニル基、4-(4-メトキシベンジルオキシ)フェニル基、 25 4-(3, 4-ジメトキシベンジルオキシ) フェニル基、4-(2, 4, 6-ト リメトキシベンジルオキシ) フェニル基、4-「2-(4-トリフルオロメトキ シフェニル) エトキシ] フェニル基、4- [3-(4-トリフルオロメトキシフ

ェニル)プロポキシ]フェニル基、4-「4-(4-トリフルオロメトキシフェ

ニル)ブトキシ〕フェニル基等のフェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原 子;シアノ基;置換基としてC1~6アルキル基を有することのあるアミノ基; ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未 置換の $C1\sim6$ アルコキシ基; $C1\sim6$ アルコキシカルボニル基; カルボキシル 基;フェノキシ基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未 置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ 基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよ い。];アミノC1~6アルキル基[アミノ基上にはフェニル基(フェニル環上 には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロ ゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1 10 ~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい。)及びC1~6アルキル基な る群より選ばれた基を $1\sim2$ 個有していてもよい。]及びフェニル $C1\sim6$ アル コキシ基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1 ~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からな る群より選ばれた基が $1 \sim 5$ 個、好ましくは $1 \sim 3$ 個置換していてもよい。]か らなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい) を挙げることができる。

ビフェニリル基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6
アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい)としては、例えば、2ービフ
20 エニリル基、3ービフェニリル基、4ービフェニリル基、2'ーメチルー2ービフェニリル基、3'ーメチルー3ービフェニリル基、3'ーメチルー3ービフェニリル基、3'ーメチルー3ービフェニリル基、3'ーメチルー4ービフェニリル基、3'ーメチルー4ービフェニリル基、4'ーメチルー2ービフェニリル基、3',
25 4'ージメチルー2ービフェニリル基、2', 4', 6'ートリメチルー3ービフェニリル基、2'ートリフルオロメチルー4', 6'ージメチルー3ービフェニリル基、2'ートリフルオロメチルー4', 6'ージメチルー3ービフェニリル基、3'ートリフルオロメチルー4ービフェニリル基、3'ートリフルオロメチルー4ービフェニリル基、3'ートリフルオロメチ

ルー3-ビフェニリル基、3, ートリフルオロメチルー4ービフェニリル基、4, ートリフルオロメチルー2ービフェニリル基、4, ートリフルオロメチルー3ービフェニリル基、4, ートリフルオロメチルー4ービフェニリル基等のビフェニリル基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基が1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

C1~6アルコキシカルボニル基が置換したアミノ基としては、例えば、メトキシカルボニルアミノ基、エトキシカルボニルアミノ基、nープロポキシカルボニルアミノ基、tertーブトキシカルボニルアミノ基、Nーペントキシカルボニルアミノ基、Nーペキシルオキシカルボニルアミノ基、Nーペントキシカルボニルアミノ基、Nーペキシルオキシカルボニルアミノ基、NーメチルーNーメトキシカルボニルーNーメチルアミノ基、NーメチルーNー(nープロポキシカルボニル)アミノ基、NーメチルーNー(イソプロポキシカルボニル)アミノ基、Nー(tertーブトキシカルボニル)ーNーメチルアミノ基、NーメチルーNー(nーペントキシカルボニル)アミノ基、Nー(nーペキシルボニル)アミノ基、Nー(nーペントキシカルボニル)アミノ基、Nー(nーペキシルオキシカルボニ

ル) -N-メチルアミノ基、N-エチル-N-メトキシカルボニルアミノ基、N-エチル-N-エトキシカルボニルアミノ基、N-エチル-N-(n-プロポキシカルボニル) アミノ基, N-エチル-N-イソプロポキシカルボニルアミノ基、N-エチル-N-(tert-ブトキシカルボニル) -N-エチルアミノ基、N-エチル-N-(n-ペントキシカルボニル) アミノ基、N-エチル-N-(n-ヘキシルオ20 キシカルボニル) アミノ基等のC1~6アルコキシカルボニル基が置換したアミノ基 (アミノ基上には、他の置換基としてC1~6アルキル基を有していてもよい) を挙げることができる。

フェニルアミノ基(フェニル環上には、ハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置 換していてもよい)としては、例えば、フェニルアミノ基、2ーメチルフェニルアミノ基、3ーメチルフェニルアミノ基、4ーメチルフェニルアミノ基、2ーエチルフェニルアミノ基、3ーエチルフェニルアミノ基、4ーエチルフェニルアミノ基、4ープロピルフェニルアミノ基、4ーtertーブチルフェニルアミノ基、4ープチルフェニルアミノ基、4ープロピルフェニルアミノ基、4ーでチルフェニルアミノ基、4ーブチルフェニルアミノ基、3ー

トリフルオロメチルフェニルアミノ基、4-トリフルオロメチルフェニルアミノ 基、2ーペンタフルオロエチルフェニルアミノ基、3ーペンタフルオロエチルフ エニルアミノ基、2、3-ジメチルフェニルアミノ基、3、4、5-トリメチル フェニルアミノ基、4ーペンチルフェニルアミノ基、4ーヘキシルフェニルアミ ノ基、N-フェニル-N- (2-フルオロフェニル) アミノ基、2-フルオロフ エニルアミノ基、3-フルオロフェニルアミノ基、4-フルオロフェニルアミノ 基、2ークロロフェニルアミノ基、3-クロロフェニルアミノ基、4-クロロフ エニルアミノ基、2-ブロモフェニルアミノ基、3-ブロモフェニルアミノ基、 4 ーブロモフェニルアミノ基、2 ーヨードフェニルアミノ基、3 ーヨードフェニ 10 ルアミノ基、4-ヨードフェニルアミノ基、2、3-ジフルオロフェニルアミノ 基、3、4ージフルオロフェニルアミノ基、3、5ージフルオロフェニルアミノ 基、2、4-ジフルオロフェニルアミノ基、2、6-ジフルオロフェニルアミノ 基、2、3-ジクロロフェニルアミノ基、3、4-ジクロロフェニルアミノ基、 3, 5 - ジクロロフェニルアミノ基、2, 4 - ジクロロフェニルアミノ基、2, 6-ジクロロフェニルアミノ基、3,4,5-トリフルオロフェニルアミノ基、 15 2, 3, 4, 5, 6ーペンタフルオロフェニルアミノ基、3, 4, 5ートリクロ ロフェニルアミノ基、2,4,6-トリフルオロフェニルアミノ基、2,4,6 ートリクロロフェニルアミノ基等のフェニル基を1~2個有するアミノ基(フェ ニル環上には、ハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキ 20 ル基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していても

ベンゾイルC1~6アルキル基(フェニル環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい。)としては、例えば、ベンゾイルメチル基、2ーフルオロベンゾイルメチル基、4ーフルオロ 3ーフルオロベンゾイルメチル基、4ーフルオロ (2, 3ージクロロベンゾイル) メチル基、(2, 3ージクロロベンゾイル) メチル基、(2, 3ージクロロベンゾイル) メチル基、(2, 3, 4, 5, 6ーペンタフルオロベンゾイル) メチル基、3ークロロベンゾイルメチル基、4ークロロベンゾイルメチル基、2ーブロモベンゾイルメチル基、3ーブロモベンゾイルメチル基、4ーブロモベンゾイルメチル基、2ーベンゾイルエチ

よい)を挙げることができる。

ル基、2-(2-フルオロベンゾイル) エチル基、2-(3-フルオロベンゾイル) エチル基、2-(4-フロロベンゾイル) エチル基、2-(4-クロロベンゾイル) エチル基、2-(4-クロロベンゾイル) エチル基、2-(4-クロロベンゾイル) エチル基、3-(3-クロロベンゾイル) プロピル基、3-(3-クロロベンゾイル) プロピル基、3-(3-クロロベンゾイル) プロピル基、4-(2-クロロベンゾイル) ブチル基、4-(3-クロロベンゾイル) ブチル基、4-(4-クロロベンゾイル) ブチル基、5-(2-クロロベンゾイル) ペンチル基、5-(4-クロロベンゾイル) ペンチル基、5-(4-クロロベンゾイル) ペンチル基、6-(3-クロロベンゾイル) ペンチル基、6-(3-クロロベンゾイル) ヘキシル基、6-(3-クロロベンゾイル) ヘキシル基、等のベンゾイル ハキシル基、6-(4-クロロベンゾイル) ヘキシル基、等のベンゾイル 1~6アルキル基(フェニル環上には置換基としてハロゲン原子を1~5個有していてもよい。)を挙げることができる。

フェニルカルバモイルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン置換 もしくは未置換のC1~6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい)と しては、例えば、フェニルカルバモイルメチル基、2-メチルフェニルカルバモ 15 イルメチル基、3-メチルフェニルカルバモイルメチル基、4-メチルフェニル カルバモイルメチル基、2,3-ジメチルフェニルカルバモイルメチル基、2, 4-ジメチルフェニルカルバモイルメチル基、2,6-ジメチルフェニルカルバ モイルメチル基、2,4,6-トリメチルフェニルカルバモイルメチル基、2-トリフルオロメチルフェニルカルバモイルメチル基、3-トリフルオロメチルフ 20 エニルカルバモイルメチル基、4ートリフルオロメチルフェニルカルバモイルメ チル基、2,3-ジトリフルオロメチルフェニルカルバモイルメチル基、2,4 ージトリフルオロメチルフェニルカルバモイルメチル基、2,6-ジトリフルオ ロメチルフェニルカルバモイルメチル基、2-ペンタフルオロエチルフェニルカ ルバモイルメチル基、3-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイルメチル基、 25 4-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイルメチル基、2-(n-プロピル フェニル)カルバモイルメチル基、3-(n-プロピルフェニル)カルバモイル メチル基、4-(n-プロピルフェニル)カルバモイルメチル基、2-(フェニ ルカルバモイル) エチル基、2-(3-トリフルオロメチルフェニルカルバモイ

- ル) エチル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニルカルバモイル) エチル基、 2-(2,3-ジトリフルオロメチルフェニルカルバモイル)エチル基、2-(2, 4-ジトリフルオロメチルフェニルカルバモイル) エチル基、2-(2, 6 - ジトリフルオロメチルフェニルカルバモイル) エチル基、2 - (2 - ペンタ フルオロエチルフェニルカルバモイル) エチル基、2-(3-ペンタフルオロエ 5 チルフェニルカルバモイル) エチル基、2-(4-ペンタフルオロエチルフェニ ルカルバモイル)エチル基、3- (フェニルカルバモイル)プロピル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニルカルバモイル) プロピル基、3-(4-トリ フルオロメチルフェニルカルバモイル)プロピル基、3-(2,3-ジトリフル オロメチルフェニルカルバモイル)プロピル基、3-(2,4-ジトリフルオロ 10 メチルフェニルカルバモイル)プロピル基、3-(2,6-ジトリフルオロメチ ルフェニルカルバモイル)プロピル基、3-(2-ペンタフルオロエチルフェニ ルカルバモイル)プロピル基、3-(3-ペンタフルオロエチルフェニルカルバ モイル)プロピル基、3-(4-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイル) プロピル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニルカルバモイル)ブチル基、 15 5-(4-トリフルオロメチルフェニルカルバモイル)ペンチル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニルカルバモイル)へキシル基等のフェニルカルバモイ ルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1 ~6アルキル基が1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。
- 20 チアゾリルC 1~6アルキル基(チアゾール環上には、ハロゲン置換もしくは 未置換のフェニル基及びC 1~6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なく とも1種が置換していてもよい)としては、例えば、4ーチアゾリルメチル基、 5ーチアゾリルメチル基、2ーメチルー4ーチアゾリルメチル基、2ーメチルー 5ーチアゾリルメチル基、2,5ージメチルー4ーチアゾリルメチル基、2,4 25 ージメチルー5ーチアゾリルメチル基、2ーメチルー5ーフェニルー4ーチアゾ リルメチル基、2ーメチルー4ーフェニルー5ーチアゾリルメチル基、2ーフェ ニルー4ーチアゾリルメチル基、2ーフェニルー5ーチアゾリルメチル基、2ーフェニルー4ーチアゾリルメチル基、2ーフェニルー5ーチアゾリルメチル基、2ーフェニルー5ーメチルー 5ーチアゾリルメチル基、2ーメチルー5ー(2ーフルオロフェニル)ー4ーチ

アゾリルメチル基、2-メチル-4-(2-フルオロフェニル)-5-チアゾリ ルメチル基、2- (2-クロロフェニル) - 4-チアゾリルメチル基、2- (2 ーブロモフェニル) -5-チアゾリルメチル基、2-(2-フルオロフェニル) -5-メチル-4-チアゾリルメチル基、2-(2-フルオロフェニル)-4-5 メチルー5ーチアゾリルメチル基、2ーメチルー5ー(3ーヨードフェニル)ー 4-チアゾリルメチル基、2-メチル-4-(3-フルオロフェニル)-5-チ アゾリルメチル基、2-(2,3-ジフルオロフェニル)-4-チアゾリルメチ ル基、2-(3-フルオロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(3-フ ルオロフェニル) - 5 - メチル- 4 - チアゾリルメチル基、2 - (3 - フルオロ 10 フェニル) -4-メチル-5-チアゾリルメチル基、2-メチル-5-(2, 4, 6-トリクロロフェニル) -4-チアゾリルメチル基、2-メチル-4-(2, 3, 4, 5, 6ーペンタフルオロフェニル) - 5 - チアゾリルメチル基、2 -(4-フルオロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、4-(2-フルオロフェ ニル) - 5 - チアゾリルメチル基、2 - (4 - フルオロフェニル) - 5 - メチル 15 -4-チアゾリルメチル基、2-(4-フルオロフェニル)-4-メチル-5-チアゾリルメチル基、2-メチル-5-(2-クロロフェニル)-4-チアゾリ ルメチル基、2ーメチルー4ー(2ークロロフェニル)-5ーチアゾリルメチル 基、2-(2-クロロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-(2-クロロ フェニル) -5-チアゾリルメチル基、2-(2-クロロフェニル) -5-メチ 20 ルー4ーチアゾリルメチル基、2- (2-クロロフェニル)-4-メチル-5-チアゾリルメチル基、2-メチル-5-(3-クロロフェニル)-4-チアゾリ ルメチル基、2ーメチルー4ー(3ークロロフェニル)-5-チアゾリルメチル 基、2-(3-クロロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-(2-フルオ ロフェニル) -5-チアゾリルメチル基、2-(3-クロロフェニル) -5-メ チルー4ーチアゾリルメチル基、2ー(3ークロロフェニル)-4ーメチル-5 ーチアゾリルメチル基、2-メチルー5-(4-クロロフェニル)-4-チアゾ リルメチル基、2-メチル-4-(4-クロロフェニル)-5-チアゾリルメチ ル基、2-(4-クロロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-(4-クロ ロフェニル)ー5ーチアゾリルメチル基、2ー(4ークロロフェニル)-5ーメ

チルー4ーチアゾリルメチル基、2-(4-クロロフェニル)-4-メチル-5 ーチアゾリルメチル基、2-(2-チアゾリル)エチル基、2-(4-チアゾリ ル) エチル基、2-(5-チアゾリル) エチル基、2-(2-メチル-4-チア ブリル)エチル基、2-(2-メチル-5-チアブリル)エチル基、2-(2, 5 5-ジメチル-4-チアゾリル)エチル基、2-(2,4-ジメチル-5-チア ゾリル) エチル基、2-(2-メチル-5-フェニル-4-チアゾリル) エチル 基、2- (2-メチル-4-フェニル-5-チアゾリル)エチル基、2- (2-フェニルー4-チアゾリル)エチル基、2-(2-フェニル-5-チアゾリル) エチル基、2- (2-フェニル-5-メチル-4-チアゾリル) エチル基、3-(2-チアゾリル)プロピル基、2-(4-チアゾリル)プロピル基、3-(5 10 ーチアゾリル)プロピル基、3-(2-メチル-4-チアゾリル)プロピル基、 2-(2-メチル-5-チアゾリル)プロピル基、3-(2,5-ジメチル-4 ーチアゾリル)プロピル基、3-(2,4-ジメチル-5-チアゾリル)プロピ ル基、3-(2-メチル-5-フェニル-4-チアゾリル)プロピル基、3-(2-メチル-4-フェニル-5-チアゾリル)プロピル基、2-(2-フェニ 15 ルー4ーチアゾリル)プロピル基、3ー(3ーフェニルー5ーチアゾリル)プロ ピル基、3-(2-フェニル-5-メチル-4-チアゾリル)プロピル基、4-(2-チアゾリル) ブチル基、4-(4-チアゾリル) ブチル基、3-(5-チ アゾリル)ブチル基、4-(2-メチル-4-チアゾリル)ブチル基、4-(2 20 -メチルー5-チアゾリル) ブチル基、4-(2,5-ジメチル-4-チアゾリ ル) ブチル基、4ー(2,4-ジメチル-5-チアゾリル) ブチル基、4-(2 ーメチルー5-フェニルー4ーチアゾリル)ブチル基、4-(2-メチルー4-フェニルー5ーチアゾリル) ブチル基、4-(2-フェニル-4-チアゾリル) ブチル基、4-フェニル-5-チアゾリル)ブチル基、4-(2-フェニル-5 -メチル-4-チアゾリル)ブチル基、5-(2-チアゾリル)ペンチル基、5 25 - (4-チアゾリル)ペンチル基、5-(5-チアゾリル)ペンチル基、5-(2-メチルー4-チアゾリル)ペンチル基、5-(2-メチル-5-チアゾリ ル)ペンチル基、5-(2,5-ジメチル-4-チアゾリル)ペンチル基、5-(2、4-ジメチル-5-チアゾリル)ペンチル基、5-(2-メチル-5-フ

ェニルー4ーチアゾリル)ペンチル基、5-(2-メチル-4-フェニル-5-チアゾリル)ペンチル基、5-(2-フェニル-4-チアゾリル)ペンチル基、 5- (4-フェニル-5-チアゾリル)ペンチル基、5-(2-フェニル-5-メチルー4ーチアゾリル)ペンチル基、5-(2ーチアゾリル)へキシル基、5 --(4-チアゾリル)ヘキシル基、5-(5-チアゾリル)ヘキシル基、5-(2-メチル-4-チアゾリル) ヘキシル基、5-(2-メチル-5-チアゾリ ル) ヘキシル基、5-(2,5-ジメチル-4-チアゾリル) ヘキシル基、5-(2.4-ジメチルー5ーチアゾリル) ヘキシル基、5-(2-メチルー5-フ ェニルー4ーチアゾリル) ヘキシル基、5ー(2ーメチルー4ーフェニルー5ー 10 チアゾリル)へキシル基、5-(2-フェニル-4-チアゾリル)へキシル基、 4-フェニルー5ーチアゾリル)へキシル基、5-(2-フェニルー5ーメチル - 4 - チアゾリル) ヘキシル基等のチアゾリルC1~6アルキル基(チアゾール 環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基及びC1~6アルキル基か らなる群より選ばれた基が1~2個置換していてもよい)を挙げることができる。 オキサゾリルC1~6アルキル基(オキサゾール環上には、ハロゲン置換もし 15 くは未置換のフェニル基及びC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基の少 なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、4-オキサゾリルメチ ル基、5-オキサゾリルメチル基、2-メチル-4-オキサゾリルメチル基、2 - メチル- 5 - オキサゾリルメチル基、2、5 - ジメチル-4 - オキサゾリルメ チル基、2,5-ジフェニルー4-オキサゾリルメチル基、2,4-ジメチルー 20 5-オキサゾリルメチル基、2-メチル-5-フェニル-4-オキサゾリルメチ ル基、2-メチルー4-フェニルー5-オキサゾリルメチル基、2-フェニルー 4-オキサゾリルメチル基、2-フェニル-5-オキサゾリルメチル基、2-フ ェニルー5-メチルー4-オキサゾリルメチル基、2-フェニルー4-メチルー 5- オキサゾリルメチル基、2-メチル-5-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフ 25 ルオロフェニル) -4-オキサゾリルメチル基、2-メチル-4-(2-フルオ ロフェニル) -5-オキサゾリルメチル基、2-(2,4-ジフルオロフェニ ル) - 4-オキサゾリルメチル基、2-(2-フルオロフェニル) - 5-オキサ

ゾリルメチル基、2-(2-フルオロフェニル)-5-メチル-4-オキサゾリ

ルメチル基、2-(2-フルオロフェニル)-4-メチル-5-オキサゾリルメ チル基、2-メチル-5-(3-フルオロフェニル)-4-オキサゾリルメチル 基、2-メチル-4-(3-フルオロフェニル)-5-オキサゾリルメチル基、 2- (3-フルオロフェニル) -4-オキサゾリルメチル基、2- (3-フルオ ロフェニル) -5-オキサゾリルメチル基、2-(3-フルオロフェニル) -5 5 ーメチルー4ーオキサゾリルメチル基、2- (3-フルオロフェニル) -4-メ チルー5-オキサゾリルメチル基、2-メチル-5-(4-フルオロフェニル) - 4-オキサゾリルメチル基、2-メチル-4-(4-フルオロフェニル)-5 ーオキサゾリルメチル基、2- (4-フルオロフェニル) -4-オキサゾリルメ チル基、2-(4-フルオロフェニル)-5-オキサブリルメチル基、2-(4 10 ーフルオロフェニル)-5-メチル-4-オキサゾリルメチル基、2-(4-ブ ロモフェニル) -4-メチル-5-オキサゾリルメチル基、2-メチル-5-(2-クロロフェニル)-4-オキサゾリルメチル基、2-メチル-4-(2-クロロフェニル)-5-オキサゾリルメチル基、2-(2-クロロフェニル)-4ーオキサゾリルメチル基、2-(2-ヨードフェニル)-5-オキサゾリルメ 15 チル基、2-(2-クロロフェニル)-5-メチル-4-オキサゾリルメチル基、 2- (2-クロロフェニル) -4-メチル-5-オキサゾリルメチル基、2-メ チルー5-(3-クロロフェニル)-4-オキサゾリルメチル基、2-メチル-4- (3-クロロフェニル) - 5-オキサゾリルメチル基、2- (3-クロロフ エニル) -4-オキサゾリルメチル基、2-(2,4.6-トリクロロフェニ 20 ル) - 5 - オキサゾリルメチル基、2 - (3 - クロロフェニル) - 5 - メチルー 4-オキサゾリルメチル基、2-(3-クロロフェニル)-4-メチル-5-オ キサゾリルメチル基、2-メチル-5-(4-クロロフェニル)-4-オキサゾ リルメチル基、2-メチル-4-(4-クロロフェニル)-5-オキサゾリルメ チル基、2-(4-クロロフェニル)-4-オキサゾリルメチル基、2-(4-25 クロロフェニル) -5-オキサゾリルメチル基、2-(4-クロロフェニル) -5-メチル-4-オキサゾリルメチル基、2-(4-クロロフェニル)-4-メ チルー5ーオキサブリルメチル基、2- (4ーオキサブリル) エチル基、2-(5-オキサゾリル) エチル基、2-(2-メチル-4-オキサゾリル) エチル

る。

基、2-(2-メチル-5-オキサゾリル)エチル基、2-(2-フェニル-5 ーメチルー4ーオキサゾリル)エチル基、2ー[2-(4-クロロフェニル)ー 5-メチルー4-オキサゾリル]エチル基、3-(4-オキサゾリル)プロピル 基、3-(5-オキサゾリル)プロピル基、3-(2-メチル-4-オキサゾリ 5 ル)プロピル基、3-(2-メチル-5-オキサゾリル)プロピル基、3-(2 ーフェニルー5ーメチルー4ーオキサゾリル)プロピル基、3ー「2ー(4ーク ロロフェニル) -5-メチル-4-オキサゾリル] プロピル基、4-(4-オキ サゾリル) ブチル基、4-(5-オキサゾリル) ブチル基、4-(2-メチルー 4-オキサゾリル)ブチル基、4-(2-メチル-5-オキサゾリル)ブチル基、 4- (2-フェニル-5-メチル-4-オキサゾリル) ブチル基、4- [2-10 (4-クロロフェニル) -5-メチル-4-オキサゾリル] ブチル基、5-(4 ーオキサゾリル)ペンチル基、5ー(5ーオキサゾリル)ペンチル基、5ー(2 ーメチルー4ーオキサゾリル)ペンチル基、5-(2-メチルー5ーオキサゾリ ル)ペンチル基、5-(2-フェニル-5-メチル-4-オキサブリル)ペンチ ル基、5-[2-(4-クロロフェニル)-5-メチル-4-オキサゾリル]ペ ンチル基、6-(4-オキサゾリル)へキシル基、6-(5-オキサゾリル)へ キシル基、6-(2-メチル-4-オキサゾリル)へキシル基、6-(2-メチ ルー5ーオキサゾリル) ヘキシル基、6-(2-フェニルー5-メチルー4-オ キサゾリル) ヘキシル基、6-[2-(4-クロロフェニル) -6-メチル-4 - オキサゾリル] ヘキシル基等のオキサゾリルC1~6アルキル基(オキサゾー 20 ル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基及びC1~6アルキル基 からなる群より選ばれた基が1~2個置換していてもよい)を挙げることができ

インドリルC1~6アルキル基としては、例えば、インドリン-1-イルメチル基、インドリン-2-イルメチル基、インドリン-3-イルメチル基、インドリン-6-イリン-4-イルメチル基、インドリン-5-イルメチル基、インドリン-6-イルメチル基、インドリン-7-イルメチル基、2-(インドリン-3-イル)エチル基、3-(インドリン-3-イル)プロピル基、4-(インドリン-3-イル)ブチル基、5-(インドリン-3-イル)ペンチル基、6-(インドリン-

3-イル)へキシル基、2- (インドリン-4-イル)エチル基、3- (インドリン-4-イル)プロピル基、4- (インドリン-4-イル)ブチル基、5- (インドリン-4-イル)ペンチル基、6- (インドリン-4-イル)へキシル基、2- (インドリン-5-イル)エチル基、3- (インドリン-5-イル)プロピル基、4- (インドリン-5-イル)ブチル基、5- (インドリン-5-イル)ペンチル基、6- (インドリン-5-イル)へキシル基、2- (インドリン-6-イル)エチル基、3- (インドリン-6-イル)プロピル基、4- (インドリン-6-イル)プロピル基、4- (インドリン-6-イル)ブチル基、6- (インドリン-6-イル)ベンチル基、6- (インドリン-6-イル)へキシル基、2- (インドリン-7-イル)エチル基、3- (インドリン-7-イル)プロピル基、4- (インドリン-7-イル)ブチル基、3- (インドリン-7-イル)プロピル基、4- (インドリン-7-イル)ブチル基、3- (インドリン-7-イル)プロピル基、4- (インドリン-7-イル)ブチ

10 3-(インドリン-7-イル)プロピル基、4-(インドリン-7-イル)ブチル基、5-(インドリン-7-イル)ペンチル基、6-(インドリン-7-イル)ペンチル基、6-(インドリン-7-イル)ペキシル基等を挙げることができる。

フリルC1~6アルキル基(フラン環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基が少なくとも1個置換していてもよい)としては、例えば、2-フリ15 ルメチル基、1-(3-フリル)エチル基、2-(2-フリル)エチル基、3-(3-フリル)プロピル基、4-(3-フリル)ブチル基、5-(2-フリル)ペンチル基、6-(2-フリル)へキシル基、2-メチル-3-(3-フリル)プロピル基、1,1-ジメチル-2-(2-フリル)エチル基、3,4-ジフェニル-2-フリルメチル基、3,4,5-トリフェニル-2-フリルメチル基、

- 20 5-フェニル-2-フリルメチル基、<math>5-(2-フルオロフェニル)-2-フリルメチル基、5-(3-フルオロフェニル)-2-フリルメチル基、<math>5-(4-フルオロフェニル)-2-フリルメチル基、5-(2-クロロフェニル)-2-フリルメチル基、5-(3-クロロフェニル)-2-フリルメチル基、<math>5-(4-クロロフェニル)-2-フリルメチル基、5-(4-クロロフェニル)-2-フリルメチル基、5-(2-ブロモフェニル)-2-
- 25 フリルメチル基、5-(3-ブロモフェニル)-2-フリルメチル基、5-(4-ブロモフェニル)-2-フリルメチル基、4-フェニルー2-フリルメチル基、4-(2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニル)-2-フリルメチル基、4-(3,4-ジフルオロフェニル)-2-フリルメチル基、4-(4-ヨードフェニル)-2-フリルメチル基、4-(2,3-ジクロロフェニル)-2-フ

リルメチル基、4-(3-クロロフェニル) -2-フリルメチル基、4-(2,4,6-トリクロロフェニル) -2-フリルメチル基、4-(2ープロモフェニル) -2-フリルメチル基、4-(2ープロモフェニル) -2-フリルメチル基、4-(3ープロモフェニル) -2-フリルメチル基、4-(4ープロモフェニル) -2-フリルメチル基、5-フェニル-2-フリル メチル基、2-(2-フリル) エチル基、3-(2-フリル) プロピル基、4-(2-フリル) ブチル基、5-(2-フリル) ペンチル基、6-(2-フリル) ヘキシル基、2-[5-(4-クロロフェニル) -2-フリル] プロピル基、4-[5-(4-クロロフェニル) -2-フリル] プロピル基、4-[5-(4-クロロフェニル) -2-フリル] ブチル基、5-(2-フリル) ペンチル基、6-10 [5-(4-クロロフェニル) -2-フリル] ヘキシル基等のフリルC1~6アルキル基(フラン環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基が1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

イミダゾリルC 1~6アルキル基(イミダゾール環上には、フェニル基が置換していてもよい)としては、例えば、4ーイミダゾリルメチル基、2ー(4ーイ15 ミダゾリル)エチル基、3ー(2ーイミダゾリル)プロピル基、4ー(1ーイミダゾリル)ブチル基、5ー(5ーイミダゾリル)ペンチル基、6ー(4ーイミダゾリル)へキシル基、2,5ージフェニルー1ーイミダゾリルメチル基、2ーフェニルー4ーイミダゾリルメチル基、2ーフェニルー4ーイミダゾリルメチル基、3ー(2ーフェニルー4ーイミダゾリル)プロピル基、4ー(2ーフェニルー5ーイミダゾリル)ブチル基、5ー(2ーフェニルー4ーイミダゾリル)パンチル基、6ー(2ーフェニルー4ーイミダゾリル)へキシル基等のイミダゾリルC1~6アルキル基(イミダゾール環上には、フェニル基が1~2個置換していてもよい)を挙げることができる。

キノリルC 1~6アルキル基としては、例えば、4ーキノリルメチル基、2-25 (4ーキノリル) エチル基、3-(4ーキノリル) プロピル基、4-(4ーキノリル) ブテル基、5-(4ーキノリル) ペンチル基、6-(4ーキノリル) へキシル基、5-キノリルメチル基、2-(5ーキノリル) エチル基、3-(5ーキノリル) プロピル基、4-(5ーキノリル) ブチル基、5-(5ーキノリル) ペンチル基、6-(5ーキノリル) ヘキシル基、6-キノリルメチル基、2-(6

ーキノリル)エチル基、3-(6-キノリル)プロピル基、4-(6-キノリル)ブチル基、5-(6-キノリル)ペンチル基、6-(6-キノリル)へキシル基、7-キノリルメチル基、2-(7-キノリル)エチル基、3-(7-キノリル)プロピル基、4-(7-キノリル)ブチル基、5-(7-キノリル)ペンチル基、6-(7-キノリル)ペンチル基、8-キノリルメチル基、2-(8-キノリル)エチル基、3-(8-キノリル)プロピル基、4-(8-キノリル)ブチル基、5-(8-キノリル)ペンチル基、6-(8-キノリル)ペキシル基等を挙げることができる。

テトラゾリル基 (テトラゾール環上には、フェニル基が置換していてもよい)

10 としては、例えば、5-(1H) ーテトラゾリル基、1-フェニル-5-(1H) ーテトラゾリル基等が挙げられる。

フェニル基が置換していてもよいピリミジル基としては、例えば、2ーピリミジル基、3ーピリミジル基、4ーピリミジル基、4ーフェニルー2ーピリミジル基、2ーフェニルー4ーピリミジル基、4,6ージフェニルー2ーピリミジニル基等が挙げられる。

ベンゾオキサゾリル基としては、例えば、2-ベンゾオキサゾリル基、4-ベンゾオキサゾリル基、5-ベンゾオキサゾリル基、6-ベンゾオキサゾリル基、7-ベンゾオキサゾリル基等が挙げられる。

ベンゾチアゾリル基としては、例えば、ベンゾチアゾールー2ーイル基、ベン 20 ゾチアゾールー4ーイル基、ベンゾチアゾールー5ーイル基、ベンゾチアゾール ー6ーイル基、ベンゾチアゾールー7ーイル基等を挙げることができる。

フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェノキシC2~6アルカノイル基としては、例えば、フェノキシアセチル基、3ーフェノキシプロピオニル基、4ーフェノキシブチリル基、5ーフェノキシペンタノイル基、6ーフェノキシへキサノイル基、4ー(4ークロロフェノキシ)ブチリル基、5ー(4ークロロフェノキシ)ペンタノイル基、6ー(4ークロロフェノキシ)へキサノイル基、2ーフルオロフェノキシアセチル基、3ーフルオロフェノキシアセチル基、4ーフルオロフェノキシアセチル基、3ークロロフェノキシアセチル基、4ーブロモフェノキシアセチル基、4ーブロモフェノキシアセチル基、4ーブロモフェ

ノキシアセチル基、2、3ージフルオロフェノキシアセチル基、2ーフルオロー4ークロロフェノキシアセチル基、3、5ージフルオロフェノキシアセチル基、2、3、4、5、6ーペンタフルオロフェノキシアセチル基、2、4、6ートリクロロフェノキシアセチル基、3ー(2ーフルオロフェノキシ)プロピオニル基、5 3ー(3ーフルオロフェノキシ)プロピオニル基、3ー(4ーフルオロフェノキシ)プロピオニル基、3ー(2ークロロフェノキシ)プロピオニル基、3ー(3ークロロフェノキシ)プロピオニル基、3ー(4ークロロフェノキシ)プロピオニル基、3ー(2、3ージフルオロフェノキシ)プロピオニル基、3ー(2、3ージフルオロフェノキシ)プロピオニル基、3ー(2、3ージフルオロフェノキシ)プロピオニル基、3ー(2ーフルオロー4ークロロフェノキシ)プロピオニル基等のフェニル環上にハロゲンが1~5個置換していてもよいフェノキシC2~6アルカノイル基等を挙げることができる。

フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェニルチオC2~6アル カノイル基としては、ハロゲン原子が1~5個置換もしくは未置換のフェニルチ オ基とC1~6アルカノイル基で構成される基であって、例えば、フェニルチオ 15 アセチル基、3-フェニルチオプロピオニル基、4-フェニルチオブチリル基、 5-フェニルチオペンタノイル基、6-フェニルチオヘキサノイル基、4-(4 ークロロフェニル)チオブチリル基、5-(4-クロロフェニル)チオペンタノ イル基、6-(4-クロロフェニル)チオヘキサノイル基、2-フルオロフェニ 20 ルチオアセチル基、3ーフルオロフェニルチオアセチル基、4-フルオロフェニ ルチオアセチル基、2-クロロフェニルチオアセチル基、2,4-ジクロロフェ ニルチオアセチル基、2,4,6-トリクロロフェニルチオアセチル基、2,3, 4, 5, 6ーテトラフルオロフェニルチオアセチル基、3ークロロフェニルチオ アセチル基、4ークロロフェニルチオアセチル基、4ーブロモフェニルチオアセ チル基、2、3-ジフルオロフェニルチオアセチル基、2-フルオロー4-クロ 25 ロフェニルチオアセチル基、3、5-ジフルオロフェニルチオアセチル基、3-(2-フルオロフェニル) チオプロピオニル基、3-(3-フルオロフェニル) チオプロピオニル基、3-(4-フルオロフェニル)チオプロピオニル基、3-(2-クロロフェニル)チオプロピオニル基、3-(3-クロロフェニル)チオ

プロピオニル基、3-(4-クロロフェニル)チオプロピオニル基、3-(4-ブロモフェニル)チオプロピオニル基、3-(2,3-ジフルオロフェニル)チオプロピオニル基、3-(2-フルオロー4-クロロフェニル)チオプロピオニル基、3-(3,5-ジフルオロフェニル)チオプロピオニル基等を挙げることができる。

ベンゾイル基(フェニル環上にはハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基及 び置換基としてC1~6アルキル基を有することのあるアミノ基からなる群より 選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、ベンゾ イル基、2-フルオロベンゾイル基、3-フルオロベンゾイル基、4-フルオロ 10 ベンゾイル基、2,3ージフルオロベンゾイル基、3,4ージフルオロベンゾイ ル基、2-クロロベンゾイル基、3-クロロベンゾイル基、4-クロロベンゾイ ル基、2,3-ジクロロベンゾイル基、3,4-ジクロロベンゾイル基、2,4, 6-トリクロロベンゾイル基、4-ヨードベンゾイル基、2,3,4,5,6-テトラフルオロベンゾイル基、2-ブロモベンゾイル基、3-ブロモベンゾイル 15 基、4ーブロモベンゾイル基、2、3ージブロモベンゾイル基、3、4ージブロ モベンゾイル基、2ーメチルベンゾイル基、3ーメチルベンゾイル基、4ーメチ ルベンゾイル基、2、3ージメチルベンゾイル基、3、4ージメチルベンゾイル 基、3,4,5ートリメチルベンゾイル基、2ートリフルオロメチルベンゾイル 基、3-トリフルオロメチルベンゾイル基、4-トリフルオロメチルベンゾイル 20 基、2、3-ジトリフルオロメチルベンゾイル基、3、4-ジトリフルオロメチ ルベンゾイル基、2-メトキシベンゾイル基、3-メトキシベンゾイル基、4-メトキシベンゾイル基、3、4-ジメトキシベンゾイル基、2、4、6-トリメ トキシベンゾイル基、2ートリフルオロメトキシベンゾイル基、3ートリフルオ ロメトキシベンゾイル基、4ートリフルオロメトキシベンゾイル基、2ーアミノ 25 ベンゾイル基、3-アミノベンゾイル基、4-アミノベンゾイル基、2-メチル アミノベンゾイル基、3-メチルアミノベンゾイル基、4-メチルアミノベンゾ イル基、2-エチルアミノベンゾイル基、3-エチルアミノベンゾイル基、4-

エチルアミノベンゾイル基、2ープロピルアミノベンゾイル基、3ープロピルア

ミノベンゾイル基、4ープロピルアミノベンゾイル基、4ーブチルアミノベンゾイル基、4ーペンチルアミノベンゾイル基、4ーペキシルアミノベンゾイル基、2ージメチルアミノベンゾイル基、3ージメチルアミノベンゾイル基、4ージメチルアミノベンゾイル基、2ージエチルアミノベンゾイル基、3ージエチルアミノベンゾイル基、3ージエチルアミノベンゾイル基、2ージプロピルアミノベンゾイル基、4ージプロピルアミノベンゾイル基、4ージプロピルアミノベンゾイル基、4ージプロピルアミノベンゾイル基、4ージペンチルアミノベンゾイル基、4ージへキシルアミノベンゾイル基等のベンゾイル基(フェニル環上にはハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基を1~2個有することのあるアミノ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

ビフェニリルカルボニル基としては、例えば、2-ビフェニリルカルボニル基、3-ビフェニリルカルボニル基、4-ビフェニリルカルボニル基等が挙げられる。 ピリジルカルボニル基としては、例えば、2-ピリジルカルボニル基、3-ピリジルカルボニル基、4-ピリジルカルボニル基等が挙げられる。

フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェニルC 2~6アルケニルカルボニル基としては、例えば、3-フェニル-2-プロペニルカルボニル基(慣用名:シンナモイル基)、4-フェニル-2-ブテニルカルボニル基、4-20 フェニル-3-ブテニルカルボニル基、5-フェニル-2-ペンテニルカルボニル基、5-フェニル-4-ペンテニルカルボニル基、5-フェニル-3-ペンテニルカルボニル基、6-フェニル-5-ヘキセニルカルボニル基、6-フェニル-4-ペンテニルカルボニル基、6-フェニル-3-ヘキセニルオキシカルボニル基、4-フェニル-1,3-ブタジエニルカルボニル基、6-フェニル-1,3-ブタジエニルカルボニル基、6-フェニル)-2-25 3,5-ヘキサトリエニルカルボニル基、3-(2-フルオロフェニル)-2-

プロペニルカルボニル基(慣用名では、2-フルオロシンナモイル基とも呼称される)、3-(3-フルオロフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(4-フルオロフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、2、4-ジフルオロシンナモイル基、3-(2、5-ジフルオロフェニル)-2-プロペニルカルボ

ニル基、3-(3,5-ジフルオロフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、 3-(3,4-ジフルオロフェニル)-2-プロペンニルカルボニル基、3-(2, 3, 4, 5, 6ーペンタフルオロフェニル) -2-プロペンニルカルボニ ル基、3-(2-クロロフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(3-クロロフェニル) -2-プロペニルカルボニル基、3-(4-クロロフェニル) - 2 - プロペニルカルボニル基、3 - (2,4-ジクロロフェニル)-2-プロ ペニルカルボニル基、3-(2,5-ジクロロフェニル)-2-プロペニルカル ボニル基、3-(3,5-ジクロロフェニル)-2-プロペンニルカルボニル基、 3-(3, 4-ジクロロフェニル) -2-プロペンニルカルボニル基、<math>3-(2,4,6-トリクロロフェニル)-2-プロペンニルカルボニル基、3-(2-ブ 10 ロモフェニル) -2-プロペンニルカルボニル基、3-(3-ブロモフェニル) - 2 - プロペニルカルボニル基、3 - (4 - ブロモフェニル) - 2 - プロペニル カルボニル基、3-(2,4-ジブロモフェニル)-2-プロペンニルカルボニ ル基、3-(2,5-ジブロモフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(3,5-ジブロモフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(3,4-15 ジブロモフェニル) -2-プロペニルカルボニル基等のフェニル環上にハロゲン 原子が1~5個置換していてもよいフェニルC2~6アルケニルカルボニル基を 挙げることができる。

フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェニルC 1~6アルキル スルホニル基とは、上で定義したフェニル環上にハロゲンが 1~5個置換することのあるフェニルC 1~6アルキル基とスルホニル基から構成される基であって、例えば、ベンジルスルホニル基、フェネチルスルホニル基、3ーフェニルプロピルスルホニル基、4ーフェニルブチルスルホニル基、5ーフェニルペンチルスルホニル基、6ーフェニルへキシルスルホニル基、2ーフルオロベンジルスルホニル基、2ークロロベンジルスルホニル基、3ークロロベンジルスルホニル基、3ークロロベンジルスルホニル基、3ージクロロベンジルスルホニル基、3、4ージクロロベンジルスルホニル基、3、5ージクロロベンジルスルホニル基、2、4ージクロロベンジルスルホニル基、3、4、5ートリフルオロベンジルスルホニ

ル基、2,3,4,5,6-ペンタフルオロベンジルスルホニル基、2-(2-フルオロ)フェネチルスルホニル基、2-(3-フルオロ)フェネチルスルホニ ル基、2-(4-フルオロ)フェネチルスルホニル基、2-(2-クロロ)フェ ネチルスルホニル基、2-(3-クロロ)フェネチルスルホニル基、2-(4-5 クロロ)フェネチルスルホニル基、2-(2,3-ジクロロ)フェネチルスルホ ニル基、2-(3,4-ジクロロ)フェネチルスルホニル基、2-(3,5-ジ クロロ)フェネチルスルホニル基、2-(2,4-ジクロロ)フェネチルスルホ ニル基2-(3,4,5-トリフルオロ)フェネチルスルホニル基、3-(2-フルオロフェニル)プロピルスルホニル基、3-(3-フルオロフェニル)プロ ピルスルホニル基、3-(4-フルオロフェニル)プロピルスルホニル基、3-10 (2-クロロフェニル) プロピルスルホニル基、3-(3-クロロフェニル) プ ロピルスルホニル基、3-(4-クロロフェニルプロスルホニル基、2-(2. 3-ジクロロフェニル)プロピルスルホニル基、3-(3,4-ジクロロフェニ ル)プロピルスルホニル基、3-(3,5-ジクロロフェニル)プロピルスルホ 15 ニル基、3-(2,4-ジクロロフェニル)プロピルスルホニル基、3-(3, 4,5-トリフルオロフェニル)プロピルスルホニル基等を挙げることができる。 ハロゲン置換もしくは未置換のC1~8アルキル基としては、例えば、メチル基、 エチル基、n-プロピル基、イソプロピル基、n-ブチル基、イソブチル基、 tertーブチル基、secーブチル基、nーペンチル基、ネオペンチル基、3 20 ーメチルペンチル基、n-ヘキシル基、イソヘキシル基、1,3,5-トリメチ ルヘキシル基、n-ヘプチル基、6-メチルヘプチル基、1-メチルヘプチル基、 nーオクチル基、フルオロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル 基、クロロメチル基、ジクロロメチル基、トリクロロメチル基、ブロモメチル基、 ジブロモメチル基、ジクロロフルオロメチル基、2,2,2-トリフルオロエチ ル基、ペンタフルオロエチル基、2-クロロエチル基、3,3,3-トリフルオ ロプロピル基、ヘプタフルオロプロピル基、ヘプタフルオロイソプロピル基、3 ークロロプロピル基、2ークロロプロピル基、3ーブロモプロピル基、4,4, 4-トリフルオロブチル基、4,4,3,3-ペンタフルオロブチル基、4

ークロロブチル基、4ーブロモブチル基、2ークロロブチル基、5、5、5ート

ることができる。

リフルオロペンチル基、5ークロロペンチル基、6、6、6ートリフルオロヘキシル基、6ークロロヘキシル基、7ークロロヘプチル基、8ークロロオクチル基等のハロゲン原子が1~7個置換もしくは未置換のC1~8アルキル基を挙げることができる。

- 5 C1~6アルキル基を有することのあるアミノーC1~6アルキル基としては、例えば、アミメチル基、2-アミノエチル基、1-アミノエチル基、3-アミノプロピル基、4-アミノブチル基、5-アミノペンチル基、6-アミノヘキシル基、2-メチルー3-アミノプロピル基、1,1-ジメチルー2-アミノエチル基、エチルアミノメチル基、1-(プロピルアミノ)エチル基、2-(メチルア10 ミノ)エチル基、3-(イソプロピルアミノ)プロピル基、4-(n-ブチルアミノ)ブチル基、5-(n-ペンチルアミノ)ペンチル基、6-(n-ヘキシルアミノ)ヘキシル基、ジメチルアミノメチル基、(N-エメチル-N-プロピルアミノ)ヘキシル基、ジメチルアミノメチル基、(N-エメチル-N-プロピルアミノ)メチル基、2-(N-メチル-N-ヘキシルアミノ)エチル基等のC1~6アルキル基を1~2個有することのあるアミノ-C1~6アルキル基を挙げ
 - フェニル $C1\sim6$ アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキルチオ基、フェニル $C1\sim6$ アルコキシ基、ヒドロキシ基、 $C1\sim6$ アルキルスルフィニル基、
- 20 C1~6アルキルスルホニル基、C1~6アルキルスルホニルオキシ基、シアノ基、C1~6アルカノイル基、ベンゾイル基、アルキル部分にC1~6アルコキシ基を有することのあるフェニルC1~6アルキル基、アミノ基、ニトロ基、カルバモイル基、C1~6アルカノイルアミノ基、C1~6アルコキシカルボニル基、C1~6アルキルアミノカルボニル基、C1~6アルコキシカルボニルアミノ基、トリC1~6アルキルシロキシ基、ピロリル基、テトラヒドロピラニルオキシ基及びイミダゾリル基からなる群より選ばれた基が1~5個置換していても
 - よい)としては、例えば、ベンジル基、1-フェネチル基、2-フェネチル基、3-フェニルプロピル基、2-フェニルプロピル基、4-フェニルブチル基、5-フェニルペンチル基、6-フェニルへキシル基、2

- 10 6-ジクロロベンジル基、2, 4, 6-トリクロロベンジル基、3, 4, 5-トリクロロベンジル基、パーフルオロベンジル基、2-ジフルオロメチルベンジル基、3-ジフルオロメチルベンジル基、4-ジフルオロメチルベンジル基、4-クロロ-3-ジフルオロメチルベンジル基、3-クロロー4-ジフルオロメチルベンジル基、3-ブロモ-4-ジフルオロメチルベンジル基、3, 5-ジフルオ
 - 15 ロー4ージフルオロメチルベンジル基、2ーメチルベンジル基、3ーメチルベンジル基、4ーメチルベンジル基、2,3ージメチルベンジル基、2,4,6ートリメチルベンジル基、3,5ージトリフルオロメチルベンジル基、2ートリフルオロメチルベンジル基、3ートリフルオロメチルベンジル基、4ートリフルオロメチルベンジル基、4ーフルオロー3ートリフルオロメチルベンジル基、3ーフ
 - 20 ルオロー4ートリフルオロメチルベンジル基、2ーペンタフルオロエチルベンジル基、4ークロロー3ーペンタフルオロエチルベンジル基、3ークロロー4ーペンタフルオロエチルベンジル基、3ーペンタフルオロエチルベンジル基、3ーペンタフルオロエチルベンジル基、2ーメトキシベンジル基、3ーメトキシベンジル基、3ーメトキシベンジル基、2,3
- 25 ージメトキシベンジル基、2,4,6ートリメトキシベンジル基、3,5ージトリフルオロメトキシベンジル基、2ートリフルオロメトキシベンジル基、3ートリフルオロメトキシベンジル基、4ーフリフルオロメトキシベンジル基、4ーフルオロー3ートリフルオロメトキシベンジル基、3ーフルオロー4ートリフルオロメトキシベンジル基、2ーペンタフルオロエトキシベンジル基、3ーペンタフ

ルオロエトキシベンジル基、4-ペンタフルオロエトキシベンジル基、3-クロ ロー4ートリフルオロメトキシベンジル基、3-クロロー4-ペンタフルオロエ トキシベンジル基、2-(2-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(3-トリフルオロメチルフェニル) エチル基、2-(4-トリフルオロメチル フェニル) エチル基、2ートリフルオロメトキシフェニル) エチル基、3ートリ フルオロメトキシフェニル)エチル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニ ル)エチル基、2-(2-ペンタフルオロエトキシフェニル)エチル基、2-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル) エチル基、2-(4-ペンタフルオロ エトキシフェニル) エチル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル) プロピ ル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(4-トリフ ルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(2-トリフルオロメトキシフェニ ル)プロピル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェニル)プロピル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル) プロピル基、3-(3-ペンタフルオロ エトキシフェニル)プロピル基、3-(4-ペンタフルオロエトキシフェニル) プロピル基、4-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)ブチル基、5-(4 15 ートリフルオロメチルフェニル)ペンチル基、4-(4-トリフルオロメチルフ エニル)ペンチル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ペンチル基、 6-(3-トリフルオロメチルフェニル)へキシル基、6-(4-トリフルオロ メチルフェニル) ヘキシル基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ヘキ シル基、2-メチルチオベンジル基、3-メチルチオベンジル基、4-メチルチ 20 オベンジル基、2, 3-ジメチルチオベンジル基、2, 4, 6-トリメチルチオ ベンジル基、2-(2-メチルチオフェエニル)エチル基、2-(3-メチルチ オフェエニル)エチル基、2-(4-メチルチオフェエニル)エチル基、3-(4-メチルチオフェエニル)プロピル基、4-(4-メチルチオフェエニル) ブチル基、5-(4-メチルチオフェエニル)ペンチル基、6-(4-メチルチ 25 オフェエニル) ヘキシル基、2-トリフルオロメチルチオベンジル基、3-トリ フルオロメチルチオベンジル基、4-トリフルオロメチルチオベンジル基、2-(2-トリフルオロメチルチオフェエニル) エチル基、2-(3-トリフルオロ メチルチオフェエニル)エチル基、2-(4-トリフルオロメチルチオフェエニ

ル)エチル基、3-(4-トリフルオロメチルチオフェエニル)プロピル基、4 - (4-トリフルオロメチルチオフェエニル)ブチル基、5-(4-トリフルオ ロメチルチオフェエニル)ペンチル基、6-(4-トリフルオロメチルチオフェ エニル)へキシル基、2-ベンジルオキシベンジル基、3-ベンジルオキシベン ジル基、4-ベンジルオキシベンジル基、2-(2-ベンジルオキシフェニル) エチル基、2- (3-ベンジルオキシフェニル) エチル基、2- (4-ベンジル オキシフェニル)エチル基、3-(4-ベンジルオキシフェニル)プロピル基、 4- (4-ベンジルオキシフェニル) ブチル基、5- (4-ベンジルオキシフェ ニル)ペンチル基、6-(4-ベンジルオキシフェニル)へキシル基、2-(2 -フェニルエトキシ)ベンジル基、3-(2-フェニルエトキシ)ベンジル基、 10 4-(2-フェニルエトキシ)ベンジル基、2-[2-(2-フェニルエトキシ フェニル)] エチル基、2- [3- (2-フェニルエトキシフェニル)] エチル 基、2-「4-(2-フェニルエトキシフェニル)]エチル基、3-[4-(2 ーフェニルエトキシフェニル)]プロピル基、4-[4-(2-フェニルエトキ - シフェニル)] ブチル基、5-[4-(2-フェニルエトキシフェニル)] ペン 15 チル基、6-[4-(2-フェニルエトキシフェニル)] ヘキシル基、2-(3 -フェニルプロポキシ)ベンジル基、3-(3-フェニルプロポキシ)ベンジル 基、4-(3-フェニルプロポキシ)ベンジル基、2-(4-フェニルブトキ シ) ベンジル基、3-(4-フェニルブトキシ) ベンジル基、4-(4-フェニ - ルブトキシ)ベンジル基、2-メトキシカルボニルベンジル基、3-メトキシカ ルボニルベンジル基、4-メトキシカルボニルベンジル基、2-(2-メトキシ カルボニルフェニル) エチル基、2-(3-メトキシカルボニルフェニル) エチ ル基、2-(4-メトキシカルボニルフェニル)エチル基、3-(4-メトキシ カルボニルフェニル)プロピル基、4-(4-メトキシカルボニルフェニル)ブ チル基、5-(4-メトキシカルボニルフェニル)ペンチル基、6-(4-メト 25キシカルボニルフェニル)へキシル基、2-ヒドロキシベンジル基、3-ヒドロ キシベンジル基、4-ヒドロキシベンジル基、2、3-ジヒドロキシベンジル基、 2, 4, 6-トリヒドロキシベンジル基、2-(2-ヒドロキシフェニル) エチ ル基、2-(3-ヒドロキシフェニル)エチル基、2-(4-ヒドロキシフェニ

- ル)エチル基、3-(4-ヒドロキシフェニル)プロピル基、4-(4-ヒドロキシフェニル)ブチル基、5-(4-ヒドロキシフェニル)ペンチル基、6-(4-ヒドロキシフェニル)ペンチル基、6-(4-ヒドロキシフェニル)ペキシル基、2-メチルスルフィニルベンジル基、3-メチルスルフィニルベンジル基、4-メチルスルフィニルベンジル基、2,
- 5 3ージメチルスルフィニルベンジル基、2,4,6ートリメチルスルフィニルベンジル基、2ー(2ーメチルスルフィニルフェニル)エチル基、2ー(3ーメチルスルフィニルフェニル)エチル基、2ー(4ーメチルスルフィニルフェニル)エチル基、3ー(4ーメチルスルフィニルフェニル)プロピル基、4ー(4ーメチルスルフィニルフェニル)ブチル基、5ー(4ーメチルスルフィニルフェニ
- 10 ル)ペンチル基、6-(4-メチルスルフィニルフェニル)へキシル基、2-メタンスルホニルベンジル基、3-メタンスルホニルベンジル基、4-メタンスルホニルベンジル基、2,3-ジメタンスルホニルベンジル基、2,4,6-トリメタンスルホニルベンジル基、2-(3-メタンスルホニルフェニル)エチル基、2-(3-メタンスルホニルフェニル)エチル基、2-(4-メタンスルホニル
- 15 フェニル)エチル基、3 (4ーメタンスルホニルフェニル)プロピル基、4 (4ーメタンスルホニルフェニル)ブチル基、5 (4ーメタンスルホニルフェニル)ペンチル基、6 (4ーメタンスルホニルフェニル)へキシル基、2ーメタンスルホニルオキシベンジル基、3ーメタンスルホニルオキシベンジル基、4ーメタンスルホニルオキシベンジル基、2、3ージメタンスルホニルオキシベン
- 20 ジル基、2, 4, 6-トリメタンスルホニルオキシベンジル基、2-(2-メタンスルホニルオキシフェニル) エチル基、2-(3-メタンスルホニルオキシフェニル) エチル基、2-(4-メタンスルホニルオキシフェニル) エチル基、3-(4-メタンスルホニルオキシフェニル) プロピル基、4-(4-メタンスルホニルオキシフェニル) ブチル基、5-(4-メタンスルホニルオキシフェニ
- 25 ル)ペンチル基、6-(4-メタンスルホニルオキシフェニル)ペキシル基、2 ーシアノベンジル基、3-シアノベンジル基、4-シアノベンジル基、2,3-ジシアノベンジル基、2,4,6-トリシアノベンジル基、2-(2-シアノフ エニル)エチル基、2-(3-シアノフェニル)エチル基、2-(4-シアノフ エニル)エチル基、3-(4-シアノフェニル)プロピル基、4-(4-シアノ

フェニル) ブチル基、5-(4-シアノフェニル) ペンチル基、6-(4-シア ノフェニル)へキシル基、2-アセチルベンジル基、3-アセチルベンジル基、 4-アセチルベンジル基、2-(2-アセチルフェニル)エチル基、2-(3-アセチルフェニル)エチル基、2-(4-アセチルフェニル)エチル基、3-(4-アセチルフェニル)プロピル基、4-(4-アセチルフェニル)ブチル基、 5 5-(4-アセチルフェニル)ペンチル基、6-(4-アセチルフェニル)へキ シル基、2-ベンゾイルベンジル基、3-ベンゾイルベンジル基、4-ベンゾイ ルベンジル基、2-(2-ベンゾイルフェニル) エチル基、2-(3-ベンゾイ ルフェニル) エチル基、2-(4-ベンゾイルフェニル) エチル基、3-(4-ベンゾイルフェニル)プロピル基、4-(4-ベンゾイルフェニル)ブチル基、 10 5-(4-ベンゾイルフェニル)ペンチル基、6-(4-ベンゾイルフェニル) ヘキシル基、 $2-\alpha$, $\alpha-$ ジメトキシベンジルベンジル基、 $3-\alpha$, $\alpha-$ ジメト キシベンジルベンジル基、 $4-\alpha$, $\alpha-$ ジメトキシベンジルベンジル基、2- $(2-\alpha, \alpha-$ ジメトキシベンジルフェニル)エチル基、 $2-(3-(\alpha, \alpha-$ ジメトキシベンジル)フェニル)エチル基、 $2-(4-(\alpha, \alpha-i))$ メトキシベ ンジル)フェニル) エチル基、3-(4-(α, α-ジメトキシベンジル) フェ ニル)プロピル基、 $4-(4-(\alpha, \alpha-i)$ メトキシベンジル)フェニル)ブチ ル基、 $5-(4-(\alpha, \alpha-i) メトキシベンジル) フェニル) ペンチル基、<math>6 (4-(\alpha, \alpha-\widetilde{\upsilon}$ メトキシベンジル)フェニル)へキシル基、 $2-\overline{r}$ ミノベン ジル基、3-アミノベンジル基、4-アミノベンジル基、2,3-ジアミノベン 20 ジル基、2,4,6-トリアミノベンジル基、2-(2-アミノフェニル)エチ ル基、2- (3-アミノフェニル) エチル基、2- (4-アミノフェニル) エチ ル基、3-(4-アミノフェニル)プロピル基、4-(4-アミノフェニル)ブ チル基、5- (4-アミノフェニル) ペンチル基、6- (4-アミノフェニル) ヘキシル基、2-ニトロベンジル基、3-ニトロベンジル基、4-ニトロベンジ ル基、2,4-ジニトロベンジル基、2,4,6-トリニトロベンジル基、2-(2-ニトロフェニル) エチル基、2-(3-ニトロフェニル) エチル基、2-(4-ニトロフェニル) エチル基、3-(4-ニトロフェニル) プロピル基、4

- (4-ニトロフェニル) ブチル基、5-(4-ニトロフェニル) ペンチル基、

6-(4-ニトロフェニル)へキシル基、2-カルバモイルベンジル基、3-カ ルバモイルベンジル基、4-カルバモイルベンジル基、2-(2-カルバモイル フェニル)エチル基、2-(3-カルバモイルフェニル)エチル基、2-(4-カルバモイルフェニル)エチル基、3-(4-カルバモイルフェニル)プロピル 基、4-(4-カルバモイルフェニル)ブチル基、5-(4-カルバモイルフェ ニル)ペンチル基、6-(4-カルバモイルフェニル)へキシル基、2-アセチ ルアミノベンジル基、3-アセチルアミノベンジル基、4-アセチルアミノベン ジル基、2-(2-アセチルアミノフェニル)エチル基、2-(3-アセチルア ミノフェニル)エチル基、2-(4-アセチルアミノフェニル)エチル基、3-(4-アセチルアミノフェニル)プロピル基、4-(4-アセチルアミノフェニ 10 ル) ブチル基、5-(4-アセチルアミノフェニル) ペンチル基、6-(4-ア セチルアミノフェニル) ヘキシル基、2-エトキシカルボニルベンジル基、3-エトキシカルボニルベンジル基、4-エトキシカルボニルベンジル基、2-(2 -エトキシカルボニルフェニル) エチル基、2- (3-エトキシカルボニルフェ ニル) エチル基、2-(4-エトキシカルボニルフェニル) エチル基、3-(4 15 ーエトキシカルボニルフェニル)プロピル基、4-(4-エトキシカルボニルフ ェニル)ブチル基、5-(4-エトキシカルボニルフェニル)ペンチル基、6-(4-エトキシカルボニルフェニル) ヘキシル基、2-メチルアミノカルボニル ベンジル基、3-メチルアミノカルボニルベンジル基、4-メチルアミノカルボ ニルベンジル基、2-ジメチルアミノカルボニルベンジル基、3-ジメチルアミ 20 ノカルボニルベンジル基、2-エチルアミノカルボニルベンジル基、3-エチル アミノカルボニルベンジル基、4-エチルアミノカルボニルベンジル基、4-ジ メチルアミノカルボニルベンジル基、2-ジエチルアミノカルボニルベンジル基、 3-ジエチルアミノカルボニルベンジル基、4-ジエチルアミノカルボニルベン ジル基、2-(ジ-n-プロピルアミノカルボニル)ベンジル基、3-(ジ-n 25ープロピルアミノカルボニル) ベンジル基、4-(ジ-n-プロピルアミノカル ボニル)ベンジル基、2-メトキシカルボニルアミノベンジル基、3-メトキシ カルボニルアミノベンジル基、4-メトキシカルボニルアミノベンジル基、2-エトキシカルボニルアミノベンジル基、3-エトキシカルボニルアミノベンジル

基、4-エトキシカルボニルアミノベンジル基、2-(tert-ブトキシカルボニルアミノ)ベンジル基、3-(tert-ブトキシカルボニルアミノ)ベンジル基、4-トリメジル基、4-トリメチルシロキシベンジル基、4-トリメチルシロキシベンジル基、2-ピロリルベンジル基、3-ピロリルベンジル基、4-ピロリルベンジル基、2-(1-イミダゾリル)ベンジル基、3-(1-イミダゾリル)ベンジル基、3-(1-イミダゾリル)ベンジル基、4-(1-イミダゾリル)ベンジル基、2-(2-テトラヒドロピラニルオキシ)ベンジル基、3-(2-テトラヒドロピラニルオキシ)ベンジル基、4-(2-テトラヒドロピラニルオキシ)ベンジル基、4-(2-テトラヒドロピラニルオキシ)ベンジル基等を挙げることができる。

10 ベンズヒドリル基(ベンゼン環上には、ハロゲン原子、トリフルオロメチル基及びトリフルオロメトキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、ベンズヒドリル基、4,4'-ジクロロベンズヒドリル基、4,4'-ジトリフルオロメチルベンズヒドリル基、4,4'-ジトリフルオロメチルベンズヒドリル基、4,4'-ジトリフルオロメトキシベンズヒドリル基等を挙げることができる。

フェニルC 2~6アルキニル基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基の少なくとも1個が置換していてもよい)としては、例えば、2ーフェニルエチニル基、3ーフェニルー2ープロピニル基、4ーフェニルー3ーブチニル基、4ーフェニルー2ーブチニル基、5ーフェニルー4ーペ20 ンチニル基、6ーフェニルー5ーへキシニル基、2ーメチルフェニルー2ープロピニル基、3ーメチルフェニルー3ーブチニル基、4ーメチルフェニルー2ーブチニル基、2,4,6ートリメチルフェニルー5ーへキシニル基、3,5ージトリフルオロメチルフェニルー2ープロピニル基、2ートリフルオロメチルフェニルー3ーブチニル基、3ートリフルオロメチルフェニルー2ープロピニル基、2ートリフルオロメチルフェニルー2ープロピニル基等のフェニルC2~6アルキニル基(フェニル環上には、置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基を1~3個置換していてもよい。)を挙げることができる。

フェニルC2~6アルキニル基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未

置換のC1~6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい。)としては、例えば、2-フェニルエチニル基、3-フェニル-2-プロピニル基、4-フェニル-3-ブチニル基、4-フェニル-2-ブチニル基、5-フェニル-4-ペンチニル基、6-フェニル-5-ヘキシニル基、2-メチルフェニル-2-プロ ピニル基、3-メチルフェニル-3-ブチニル基、4-メチルフェニル-2-ブ チニル基、2,4,6-トリメチルフェニル-5-ヘキシニル基、3,5-ジトリフルオロメチルフェニル-2-プロピニル基、2-トリフルオロメチルフェニル-3-ブチニル基、3-トリフルオロメチルフェニル-2-ブロピニル基、2-トリフルオロメチルフェニル-3-ブチニル基、3-トリフルオロメチルフェニル-2-ブチニル基、4-トリフルオロメチルフェニル-2-ブロピニル基等のフェニルC2~6アルキニル基(フェニル環上には、置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基を1~3個置換していてもよい。)を挙げることができる。

ピリジルC1~6アルキル基としては、例えば、2-ピリジルメチル基、2-(3-ピリジル) エチル基、1-(4-ピリジル) エチル基、3-(2-ピリジ 15 ル) プロピル基、4-(3-ピリジル) ブチル基、5-(4-ピリジル) ペンチル基、6-(2-ピリジル) ヘキシル基、2-メチル-3-(3-ピリジル) プロピル基、1,1-ジメチル-2-(2-ピリジル) エチル等を挙げることができる。

ピペリジノC1~6アルキル基(ピペリジン環上には、フェニル環上に置換基20 としてハロゲン置換もしくは未置換のアルキル基を少なくとも一個有することのあるフェノキシ基が置換していてもよい)としては、例えば、ピペリジン-1ーイルメチル基、2-(ピペリジン-2-イル)エチル基、3-(ピペリジン-3-イル)プロピル基、4-(ピペリジン-4-イル)プチル基、5-(ピペリジン-1-イル)ペンチル基、6-(ピペリジン-1-イル)ヘキシル基、4-25 (4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イルメチル基、4-フェノキシピペリジン-1-イルメチル基、4-(4-メチルフェノキシ)ピペリジン-1-イルメチル基、4-(2,4-ジメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イルメチル基、4-(2,4,6-トリメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イルメチル基、4-(2,4,6-トリメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イルメチル基、2-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-

1ーイル] エチル基、3ー [4ー(4ートリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジンー1ーイル] プロピル基、4ー [4ー(4ートリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジンー1ーイル] ブチル基、5ー [4ー(4ートリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジンー1ーイル] ペンチル基、6ー [4ー(4ートリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジンー1ーイル] ヘキシル基等のピペリジノC1~6アルキル基(ピペリジン環上には、フェニル環上に置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のアルキル基を1~3個有することのあるフェノキシ基が置換していてもよい) を挙げることができる。

アミノC1~6アルキル基(アミノ基上には、C1~6アルキル基及びフェニ ル環上に置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基を有 することのあるフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換し ていてもよい)としては、例えば、アミノメチル基、2ーアミノエチル基、2ー アミノプロピル基、3-アミノプロピル基、3-アミノブチル基、4-アミノブ チル基、5-アミノペンチル基、6-アミノヘキシル基、2-メチルアミノエチ 15 ル基、2ーメチルアミノプロピル基、3ーメチルアミノプロピル基、3ーメチル アミノブチル基、4ーメチルアミノブチル基、5ーメチルアミノペンチル基、6 - メチルアミノヘキシル基、2 - (エチルアミノ) エチル基、3 - (エチルアミ ノ)プロピル基、4-(エチルアミノ)ブチル基、5-(エチルアミノ)ペンチ ル基、6-(エチルアミノ) ヘキシル基、2-(n-プロピルアミノ) エチル基、 3- (n-プロピルアミノ) プロピル基、4- (n-プロピルアミノ) ブチル基、 20 5- (n-プロピルアミノ) ペンチル基、6- (n-プロピルアミノ) ヘキシル 基、2-(n-ブチルアミノ)エチル基、3-(n-ブチルアミノ)プロピル基、 2- (n-ペンチルアミノ) エチル基、3- (n-ペンチルアミノ) プロピル基、 2- (n-ヘキシルアミノ) エチル基、3- (n-ヘキシルアミノ) プロピル基、 2-ジメチルアミノエチル基、2-ジメチルアミノプロピル基、3-ジメチルア 25 ミノプロピル基、3-ジメチルアミノブチル基、4-ジメチルアミノブチル基、 5-ジメチルアミノペンチル基、6-ジメチルアミノヘキシル基、2-(ジエチ ルアミノ) エチル基、3- (ジエチルアミノ) プロピル基、4- (ジエチルアミ ノ) ブチル基、5-(ジエチルアミノ)ペンチル基、6-(ジエチルアミノ)へ

キシル基、2-(ジ-n-プロピルアミノ) エチル基、3-(ジ-n-プロピル アミノ)プロピル基、4-(ジーn-プロピルアミノ)ブチル基、5-(ジーn ープロピルアミノ) ペンチル基、6-(ジ-n-プロピルアミノ) ヘキシル基、 2- (フェニルアミノ) エチル基、3- (フェニルアミノ) プロピル基、4-5 (フェニルアミノ)ブチル基、5-(フェニルアミノ)ペンチル基、6-(フェ ニルアミノ) ヘキシル基、2-(N-メチル-N-フェニルアミノ) エチル基、 3-(N-メチル-N-フェニルアミノ)プロピル基、4-(N-メチル-N-フェニルアミノ) ブチル基、5-(N-メチル-N-フェニルアミノ) ペンチル 基、6-(N-メチル-N-フェニルアミノ) ヘキシル基、(4-メトキシフェ 10 ニル) アミノメチル基、(3,4-ジメトキシフェニル) アミノメチル基、(2, 4,6-トリメトキシフェニル)アミノメチル基、2-(4-トリフルオロメト キシフェニルアミノ) エチル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニルアミ ノ)プロピル基、4ー(4ートリフルオロメトキシフェニルアミノ)ブチル基、 5-(4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ)ペンチル基、6-(4-トリ 15 フルオロメトキシフェニルアミノ) ヘキシル基、2-(N-メチル-N-4-ト リフルオロメトキシフェニルアミノ) エチル基、3-(N-メチル-N-4-ト リフルオロメトキシフェニルアミノ)プロピル基、4- (N-メチル-N-4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ) ブチル基、5- (N-メチル-N-4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ)ペンチル基、6-(N-メチル-N-4 ートリフルオロメトキシフェニルアミノ) ヘキシル基等の置換基としてC1~6 20 アルキル基及びフェニル環上に置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のC1 ~6アルコキシ基を1~3個有することのあるフェニル基からなる群より選ばれ た基を1~2個有することのあるアミノC1~6アルキル基を挙げることができ る。

25 1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジルC1~6アルキル基(1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン環上には、少なくとも1個のフェニル基[フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基が少なくとも1個置換していてもよい]が置換していてもよい)としては、例えば、(1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イル)メチル基、1-(1, 2, 3, 6-テト

ラヒドロピリジンー2ーイル) エチル基、2-(1,2,3,6-テトラヒドロ ピリジン-3-イル) エチル基、3-(1,2,3,6-テトラヒドロピリジン -4-イル)プロピル基、4-(1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-イル) ブチル基、5-(1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-2-イル) ペ ンチル基、6-(1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-3-イル)へキシル 基、2-メチルー3-(1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-イル)プ ロピル基、1,1ージメチルー2ー(1,2,3,6ーテトラヒドロピリジンー 4-イル) エチル基、4-フェニル-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1ーイルメチル基、3,4,5ートリフェニルー1,2,3,6ーテトラヒドロ 10 ピリジン-1-イルメチル基、3,4-ジフェニル-1,2,3,6-テトラヒ ドロピリジン-1-イルメチル基、4-(2-メトキシフェニル)-1,2,3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イルメチル基、4-(3-メトキシフェニル) -1, 2, 3, 6ーテトラヒドロピリジン-1ーイルメチル基、4-(4-メトキシフェニル)-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-イルメチル基、 15 4-(2, 4-ジメトキシフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イルメチル基、3-(2, 4, 6-トリメトキシフェニル)-1, 2, 3, .6ーテトラヒドロピリジンー1ーイルメチル基、4ー(2ートリフルオロメトキ シフェニル)-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-イルメチル基、4 -(3-1) (3-1) フルオロメトキシフェニル(3-1, 2, 3, 6-7) ラビドロピリ ジン-1-イルメチル基、4-(3,5-ジトリフルオロメトキシフェニル)-20 1,2,3,6ーテトラヒドロピリジン-1-イルメチル基、4-(4-トリフ ルオロメトキシフェニル) -1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イル メチル基、2-(4-フェニル-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-イル) エチル基、2-[4-(4-メトキシフェニル)-1,2,3,6-テト ラヒドロピリジンー1ーイル] エチル基、2-[4-(4-トリフルオロメトキ 25 シフェニル)-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-イル] エチル基、 3-(4-フェニル-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イル) プロピル基、3-[4-(4-メトキシフェニル)-1,2,3,6-テトラヒドロ

ピリジン-1-イル] プロピル基、3-[4-(4-トリフルオロメトキシフェ

ニル) -1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-イル]プロピル基、4-(4-フェニル-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イル) ブチル基、 4-[4-(4-メトキシフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イル] ブチル基、4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1, 2, 3, 6ーテトラヒドロピリジン-1-イル] ブチル基、5-(4-フェニル 5 -1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-イル)ペンチル基、5-[4-(4-)トキシフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イ ル] ペンチル基、5-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1,2, 3,6-テトラヒドロピリジン-1-イル]ペンチル基、6-(4-フェニル-10 1, 2, 3, 6ーテトラヒドロピリジン-1ーイル) ヘキシル基、6-[4-(4-)トキシフェニル) -1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イ ル] ヘキシル基、6-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1,2, 3,6ーテトラヒドロピリジン-1-イル] ヘキシル基等の1,2,3,6ーテ トラヒドロピリジルC1~6アルキル基(1,2,3,6-テトラヒドロピリジ ン環上には、置換基としてフェニル環上にハロゲン置換もしくは未置換のC1~ 15 6アルコキシ基を1~3個有することのあるフェニル基が1~3個置換していて

フルオレニルC1~6アルキル基としては、例えば、1-フルオレニルメチル基、2-フルオレニルメチル基、3-フルオレニルメチル基、4-フルオレニル 20 メチル基、9-フルオレニルメチル基、2-(1-フルオレニル)エチル基、2-(2-フルオレニル)エチル基、2-(4-フルオレニル)エチル基、2-(4-フルオレニル)エチル基、3-(1-フルオレニル)プロピル基、3-(1-フルオレニル)プロピル基、3-(3-フルオレニル)プロピル基、3-(9-フルオレニル)プロピル基、3-(9-フルオレニル)プロピル基、3-(9-フルオレニル)プロピル基、3-(9-フルオレニル)プロピル基、4-(2-フルオレニル)ブチル基、4-(2-フルオレニル)ブチル基、5-(2-フルオレニル)ブチル基、5-(2-フルオレニル)ベンチル基、6-(2-フルオレニル)ペンチル基、6-(2-フルオレニル)ペンチル基、6-(2-フルオレニル)ペンチル基、6-(2-フルオレニル)ペキシル基等を挙げることができる。

もよい。)を挙げることができる。

フリルC1~6アルキル基(フラン環上には、ハロゲン置換もしくは未置換の

フェニル基が置換していてもよい)としては、例えば、2-フリルメチル基、3 ーフリルメチル基、2-(2-フリル)エチル基、1-(3-フリル)エチル基、 3- (2-フリル)プロピル基、3- (3-フリル)プロピル基、4- (2-フ リル)ブチル基、4-(3-フリル)ブチル基、5-(2-フリル)ペンチル基、 5-(3-フリル)ペンチル基、6-(2-フリル)へキシル基、6-(3-フ リル)へキシル基、4-フェニル-2-フリルメチル基、4-(2-フルオロフ ェニル) - 2 - フリルメチル基、4 - (3 - フルオロフェニル) - 2 - フリルメ チル基、4-(4-フルオロフェニル)-2-フリルメチル基、4-(2,3, 4, 5, 6 -ペンタフルオロフェニル) -2 - フリルメチル基、4 - (2 - クロ ロフェニル) -2-フリルメチル基、4-(3-クロロフェニル) -2-フリル 10 メチル基、4-(4-クロロフェニル)-2-フリルメチル基、4-(2-ブロ モフェニル) -2-フリルメチル基、4-(3-ブロモフェニル) -2-フリル メチル基、4-(4-ブロモフェニル)-2-フリルメチル基、4-フェニルー 3-フリルメチル基、4-(2、3-ジクロロフェニル)-3-フリルメチル基、 - 4-(4-クロロフェニル)-3-フリルメチル基、4-(2-ブロモフェニ ル) -3-フリルメチル基、4-(3-ブロモフェニル) -3-フリルメチル基、 4- (4-ブロモフェニル) - 3-フリルメチル基、4-フェニルー3-フリル エチル基、2-[4-(3-クロロフェニル)-3-フリル] エチル基、2-「4-(4-クロロフェニル)-3-フリル]エチル基、2-「4-(2-ブロ モフェニル)-3-フリル] エチル基、2-[4-(3-ブロモフェニル)-3 20 -フリル] エチル基、2-[4-(2,4-ジブロモフェニル)-3-フリル] エチル基、2-(4-フェニル-2-フリル)エチル基、2-[4-(3-クロ ロフェニル) -2-フリル] エチル基、2-[4-(4-クロロフェニル) -2 ーフリル] エチル基、2- [4-(4-ブロモフェニル)-2-フリル] エチル 25 基、3-(4-フェニル-3-フリル)プロピル基、3-[4-(3-クロロフ ェニル) -3-フリル] プロピル基、3-[4-(2,4,6-トリクロロフェ ニル) - 3 - フリル] プロピル基、3 - [4 - (4 - ブロモフェニル) - 3 - フ リル] プロピル基、3-(4-フェニル-2-フリル) プロピル基、3-[4-(3-クロロフェニル)-2-フリル〕プロピル基、3-「4-(4-クロロフ

エニル) -2-フリル] プロピル基、3-[4-(4-ブロモフェニル) -2-フリル] プロピル基、4-(4-フェニル-3-フリル)ブチル基、4-[4-(3-クロロフェニル) -3-フリル] ブチル基、4-[4-(4-クロロフェ ニル) -3-フリル] ブチル基、4-[4-(4-ブロモフェニル) -3-フリ 5 ル] ブチル基、4ー(4ーフェニルー2ーフリル)ブチル基、4ー [4ー(3ー クロロフェニル) -2-フリル] ブチル基、4-[4-(4-クロロフェニル) - 2 - フリル] ブチル基、4 - [4 - (4 - ブロモフェニル) - 2 - フリル] ブ チル基、5-(4-フェニル-3-フリル)ペンチル基、5-[4-(3-クロ ロフェニル) -3-フリル] ペンチル基、5-[4-(4-クロロフェニル) -3-フリル] ペンチル基、5-[4-(4-ブロモフェニル)-3-フリル] ペ 10 ンチル基、5-(4-フェニル-2-フリル)ペンチル基、5-[4-(3-ク ロロフェニル) -2-フリル] ペンチル基、5-[4-(4-クロロフェニル) -2-フリル]ペンチル基、5-[4-(4-ブロモフェニル)-2-フリル] ペンチル基、6-(4-フェニル-3-フリル)へキシル基、6-[4-(3-クロロフェニル) -3-フリル] ヘキシル基、6-[4-(4-クロロフェニ 15 ル) -3-フリル] ヘキシル基、6-[4-(4-ブロモフェニル) -3-フリ ル] ヘキシル基、6-(4-フェニル-2-フリル) ヘキシル基、6-[4-(3-クロロフェニル) -2-フリル] ヘキシル基、6-[4-(4-クロロフ ェニル) -2-フリル] ヘキシル基、6-[4-(4-ブロモフェニル) -2-フリル]へキシル基等のフリルC1~6アルキル基(フラン環上には、ハロゲン 20 原子が1~5個置換もしくは未置換のフェニル基が置換していてもよい)を挙げ ることができる。

チエニル置換C1~6アルキル基としては、例えば、2-チエニルメチル基、3-チエニルメチル基、2-(2-チエニル)エチル基、1-(3-チエニル)25 エチル基、4-(2-チエニル)ブチル基、4-(3-チエニル)ブチル基、5-(2-チエニル)ペンチル基、5-(2-チエニル)ペンチル基、6-(2-チエニル)ヘキシル基、6-(2-チエニル)ヘキシル基、6-(3-チエニル)ヘキシル基等を挙げることができる。

オキサゾリルC1~6アルキル基(オキサゾール環上には、ハロゲン原子又は

ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基が置換していてもよい)としては、例 えば、2-オキサゾリルメチル基、4-オキサゾリルメチル基、5-オキサゾリ ルメチル基、2-(2-オキサゾリル)エチル基、1-(4-オキサゾリル)エ チル基、3-(2-オキサゾリル)プロピル基、4-(2-オキサゾリル)ブチ 5 ル基、5-(2-オキサゾリル)ペンチル基、6-(2-オキサゾリル)へキシ ル基、2- (4-オキサゾリル) エチル基、3- (4-オキサゾリル) プロピル 基、4-(4-オキサゾリル)ブチル基、5-(4-オキサゾリル)ペンチル基、 6-(4-オキサゾリル)へキシル基、2-クロロ-4-オキサゾリルメチル基、 2, 5-ジクロロー4-オキサゾリルメチル基、2, 5-ジフェニルー4-オキ サゾリルメチル基、2-(2-クロロ-4-オキサゾリル) エチル基、3-(2 10 ークロロー4ーオキサゾリル)プロピル基、4-(2-ヨード-4-オキサゾリ ル)ブチル基、5-(2-ブロモ-4-オキサゾリル)ペンチル基、6-(2-フルオロー4ーオキサゾリル) ヘキシル基、2-(4-クロロフェニル) -4-オキサゾリルメチル基、2-(2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニル) -4-オキサゾリルメチル基、2-[2-(4-クロロフェニル)-4-オキサ ゾリル] エチル基、3-[2-(4-クロロフェニル)-4-オキサゾリル] プ

ロピル基、4-[2-(2,4,6-トリクロロフェニル)-4-オキサゾリル]ブチル基、5-[2-(4-クロロフェニル)-4-オキサゾリル]ペンチル基、6-[2-(4-クロロフェニル)-4-オキサゾリル]ペキシル基、20 [2-クロロ-4-(3-クロロフェニル)-5-オキサゾリル]メチル基等の

20 【2-クロロー4-(3-クロロフェニル) -5-オキサゾリル」メチル基等の オキサゾリルC1~6アルキル基(オキサゾール環上にはハロゲン原子又はフェ ニル環上にハロゲン原子が1~5個置換することのあるフェニル基が1~2個置 換していてもよい)を挙げることができる。

オキサジアゾリルC1~6アルキル基(オキサジアゾール環上には、ハロゲン 25 置換もしくは未置換のフェニル基が置換していてもよい)としては、例えば、5 ーオキサジアゾリルメチル基、2-(5-オキサジアゾリル)エチル基、1-(2-オキサジアゾリル)エチル基、3-(5-オキサジアゾリル)プロピル基、4-(2-オキサジアゾリル)ブチル基、5-(5-オキサジアゾリル)ペンチル基、6-(2-オキサジアゾリル)へキシル基、2-メチル-3-(2-オキ

サジアゾリル)プロピル基、1,1-ジメチル-2-(5-オキサジアゾリル) エチル基、2-フェニル-5-オキサジアゾリルメチル基、2-(2-フルオロ フェニル) -5-オキサジアゾリルメチル基、2- (3-フルオロフェニル) -5ーオキサジアゾリルメチル基、2-(2,3;4,5,6-ペンタフルオロフ エニル) -5-オキサジアゾリルメチル基、2-(2,4-ジクロロフェニル) - 5 - オキサジアゾリルメチル基、2 - (3 - クロロフェニル) - 5 - オキサジ アゾリルメチル基、2-(4-クロロフェニル)-5-オキサジアゾリルメチル 基、2-(2-ブロモフェニル)-5-オキサジアゾリルメチル基、2-(2, 4,6-トリブロモフェニル)-5-オキサジアゾリルメチル基、2-(4-ブ ロモフェニル) -5-オキサジアゾリルメチル基、2-(5-オキサジアゾリ 10 ル) エチル基、3-(5-オキサジアゾリル) プロピル基、4-(5-オキサジ アゾリル)ブチル基、5-(5-オキサジアゾリル)ペンチル基、6-(5-オ キサジアゾリル) ヘキシル基、2-(2-フェニル-5-オキサジアゾリル) ェ チル基、3-(2-フェニル-5-オキサジアゾリル)プロピル基、4-(2-フェニルー5ーオキサジアゾリル)ブチル基、5ー(2ーフェニルー5ーオキサ 15 ジアゾリル)ペンチル基、6-(2-フェニル-5-オキサジアゾリル)へキシ ル基、2-[2-(4-クロロフェニル)-5-オキサジアゾリル]エチル基、 3- [2-(4-クロロフェニル)-5-オキサジアゾリル]プロピル基、4-[2-(4-クロロフェニル)-5-オキサジアゾリル]ブチル基、5-[2-(4-クロロフェニル) -5-オキサジアゾリル] ペンチル基、<math>6-[2-(420 ークロロフェニル) -5-オキサジアゾリル] ヘキシル基等のオキサジアゾリル C1~6アルキル基(オキサジアゾール環上にはハロゲン原子が1~5個置換も しくは未置換のフェニル基が置換していてもよい)を挙げることができる。

ピラゾリルC1~6アルキル基(ピラゾール環上には、ハロゲン置換もしくは 未置換のフェニル基が置換していてもよい)としては、例えば、3ーピラゾリル メチル基、2-(4-ピラゾリル)エチル基、1-(5-ピラゾリル)エチル基、 3-(3-ピラゾリル)プロピル基、4-(4-ピラゾリル)ブチル基、5- (1-ピラゾリル)ペンチル基、6-(5-ピラゾリル)へキシル基、2-メチ ルー3-(1-ピラゾリル)プロピル基、1,1-ジメチル-2-(3-ピラゾ

挙げることができる。

リル) エチル基、1-(1-フェニル-3-ピラゾリルメチル基、1-(2-フ ルオロフェニル) - 4 - ピラゾリルメチル基、1 - (3 - フルオロフェニル) -3-ピラゾリルメチル基、3-フェニル-1-ピラゾリルメチル基、3,4,5 ートリフェニルー1ーピラゾリルメチル基、3,4ージフェニルー1ーピラゾリ 5 ルメチル基、1-(4-フルオロフェニル)-3-ピラゾリルメチル基、1-(2,3,4,5,6ーペンタフルオロフェニル)-3-ピラゾリルメチル基、 1- (2-クロロフェニル) - 5-ピラゾリルメチル基、1- (3-クロロフェ ニル) -3-ピラゾリルメチル基、1-(4-クロロフェニル) -3-ピラゾリ ルメチル基、1-(2-ブロモフェニル)-3-ピラゾリルメチル基、1-(3 - ブロモフェニル)- 3 - ピラゾリルメチル基、1 - (4 - ブロモフェニル)-10 3-ピラゾリルメチル基、2-(3-ピラゾリル)エチル基、3-(3-ピラゾ リル)プロピル基、4-(3-ピラゾリル)ブチル基、5-(3-ピラゾリル) ペンチル基、6-(3-ピラゾリル) ヘキシル基、2-[1-(4-クロロフェ ニル) -3-ピラゾリル] エチル基、3-[1-(2, 4-ジクロロフェニル) - 3ーピラゾリル] プロピル基、4ー [1-(4ークロロフェニル)- 3ーピラ 15 ゾリル] ブチル基、5ー[1ー(4ークロロフェニル)-3ーピラゾリル] ペン チル基、6-[1-(2,4,6-トリクロロフェニル)-3-ピラゾリル]へ キシル基等のピラゾリルC1〜6アルキル基(ピラゾール環上にはハロゲン原子 が1~5個置換もしくは未置換のフェニル基が1~3個置換していてもよい)を

ベンゾチエニルC1~6アルキル基(ベンゾチオフェン環上には、ハロゲン原 子及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ば れた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、2-ベンゾ チエニルメチル基、2-(3-ベンゾチエニル)エチル基、1-(4-ベンゾチ エニル)エチル基、3-(5-ベンゾチエニル)プロピル基、4-(6-ベンゾ チエニル)ブチル基、5-(7-ベンゾチエニル)ペンチル基、6-(2-ベン ゾチエニル)ヘキシル基、2-メチルー3-(3-ベンゾチエニル)プロピル基、 1,1-ジメチルー2-(2-ベンゾチエニル)エチル基、4ーフルオロー2-ベンゾチエニルメチル基、5-フルオロー2-ベンゾチエニルメチル基、6-フ

ルオロー2-ベンゾチエニルメチル基、7-フルオロー2-ベンゾチエニルメチ ル基、4-クロロー2-ベンゾチエニルメチル基、5-クロロー2-ベンゾチエ ニルメチル基、6-クロロー2-ベンゾチエニルメチル基、7-クロロー2-ベ ンゾチエニルメチル基、4-ブロモー2-ベンゾチエニルメチル基、5-ブロモ - 2 - ベンゾチエニルメチル基、6 - ブロモー2 - ベンゾチエニルメチル基、7 ーブロモー2ーベンゾチエニルメチル基、4ーメトキシー2ーベンゾチエニルメ チル基、5-メトキシ-2-ベンゾチエニルメチル基、6-メトキシ-2-ベン ゾチエニルメチル基、6、7ージメトキシー2ーベンゾチエニルメチル基、3. 6、7ートリメトキシー2ーベンゾチエニルメチル基、7ーメトキシー2ーベン 10 ゾチエニルメチル基、4ートリフルオロメトキシー2ーベンゾチエニルメチル基、 5-トリフルオロメトキシー2-ベンゾチエニルメチル基、6-トリフルオロメ トキシー2-ベンゾチエニルメチル基、7-トリフルオロメトキシー2-ベンゾ チエニルメチル基、4-エトキシ-2-ベンゾチエニルメチル基、5-エトキシ -2-ベンゾチエニルメチル基、6-エトキシ-2-ベンゾチエニルメチル基、 15 7-エトキシー2ーベンゾチエニルメチル基、4ークロロー5ートリフルオロメ トキシー2-ベンゾチエニルメチル基、6-クロロ-5-トリフルオロメトキシ - 2 - ベンゾチエニルメチル基、 7 - クロロ - 5 - トリフルオロメトキシー 2 -ベンゾチエニルメチル基、3ーベンゾチエニルメチル基、4ーフルオロー3ーベ ンゾチエニルメチル基、5-フルオロー3-ベンゾチエニルメチル基、6-フル 20 オロー3ーベンゾチエニルメチル基、7ーフルオロー3ーベンゾチエニルメチル 基、4-クロロー3-ベンゾチエニルメチル基、5-クロロー3-ベンゾチエニ ルメチル基、6-クロロー3-ベンゾチエニルメチル基、7-クロロー3-ベン ゾチエニルメチル基、4ーブロモー3ーベンゾチエニルメチル基、5ーブロモー 3-ベンゾチエニルメチル基、6-ブロモー3-ベンゾチエニルメチル基、7-25 ブロモー3ーベンゾチエニルメチル基、4ーメトキシー3ーベンゾチエニルメチ ル基、5-メトキシ-3-ベンゾチエニルメチル基、6-メトキシ-3-ベンゾ チエニルメチル基、7-メトキシー3-ベンゾチエニルメチル基、4-トリフル オロメトキシー3-ベンゾチエニルメチル基、5-トリフルオロメトキシー3-ベンゾチエニルメチル基、6-トリフルオロメトキシ-3-ベンゾチエニルメチ

ル基、7ートリフルオロメトキシー3ーベンゾチエニルメチル基、4ーエトキシー -3-ベンゾチエニルメチル基、5-エトキシ-3-ベンゾチエニルメチル基、 6-エトキシ-3-ベンゾチエニルメチル基、7-エトキシ-3-ベンゾチエニ ルメチル基、4-クロロ-5-トリフルオロメトキシ-3-ベンゾチエニルメチ 5 ル基、6-クロロー5-トリフルオロメトキシー3-ベンゾチエニルメチル基、 7-クロロー5-トリフルオロメトキシー3-ベンゾチエニルメチル基、2-(2-ベンゾチエニル) エチル基、3-(2-ベンゾチエニル) プロピル基、4 - (2-ベンゾチエニル)ブチル基、5-(2-ベンゾチエニル)ペンチル基、 6-(2-ベンゾチエニル)へキシル基、2-(3-ベンゾチエニル)エチル基、 3- (3-ベンゾチエニル)プロピル基、4-(3-ベンゾチエニル)ブチル基、 10 5- (3-ベンゾチエニル)ペンチル基、6-(3-ベンゾチエニル)ヘキシル 基、2-(5-クロロ-2-ベンゾチエニル)エチル基、3-(5-クロロ-2 -ベンゾチエニル)プロピル基、4-(5-クロロ-2-ベンゾチエニル)ブチ ル基、5-(5-クロロー2-ベンゾチエニル)ペンチル基、6-(5-クロロ -2-ベンゾチエニル) ヘキシル基、2-(5-クロロ-3-ベンゾチエニル) エチル基、3-(5-クロロ-3-ベンゾチエニル)プロピル基、4-(5-ク ロロー3-ベンゾチエニル)ブチル基、5-(5-クロロー3-ベンゾチエニ ル)ペンチル基、6-(5-クロロ-3-ベンゾチエニル)へキシル基等のベン ゾチエニルC1~6アルキル基(ベンゾチオフェン環上には、ハロゲン原子及び 20 ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基 が1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

チオフェン環上にハロゲン原子が置換していてもよいチエニルC1~6アルキル基としては、例えば、2-チエニルメチル基、2-(3-チエニル)エチル基、1-(2-チエニル)エチル基、3-(2-チエニル)プロピル基、4-(3-25 チエニル)ブチル基、5-(2-チエニル)ペンチル基、6-(2-チエニル)ペンチル基、6-(2-チエニル)ペンチル基、1,1-ジメチルーシー(2-チエニル)エチル基、3-フルオロー2-チエニルメチル基、4ーフルオロー2-チエニルメチル基、3,4,5-トリクロロー2-チエニルメチル基、5-フルオロー2-チエニルメチル基、3,4,5-トリクロロー2-チエニルメチル基、5-フルオロー2-チエニル

メチル基、3-クロロー2-チエニルメチル基、4-クロロー2-チエニルメチ ル基、5-クロロー2-チエニルメチル基、3-ブロモー2-チエニルメチル基、 4-ブロモ-2-チエニルメチル基、5-ブロモ-2-チエニルメチル基、3-チエニルメチル基、2-フルオロー3-チエニルメチル基、4-フルオロー3-- チエニルメチル基、5-フルオロー3-チエニルメチル基、2-クロロー3-チ エニルメチル基、4ークロロー3ーチエニルメチル基、5ークロロー3ーチエニ ルメチル基、2-ブロモー3-チエニルメチル基、4-ブロモー3-チエニルメ チル基、5-ヨードー3-チエニルメチル基、2-(5-クロロー2-チエニ ル) エチル基、3-(5-クロロ-2-チエニル) プロピル基、4-(5-クロ 10 ロー2-チエニル)ブチル基、5-(5-クロロー2-チエニル)ペンチル基、 6-(5-クロロ-2-チエニル)へキシル基、2-(5-クロロ-3-チエニ ル) エチル基、3-(5-クロロ-3-チエニル) プロピル基、4-(5-クロ ロー3ーチエニル)ブチル基、5ー(5ークロロー3ーチエニル)ペンチル基、 6-(5-クロロー3-チエニル)へキシル基等のチオフェン環上にハロゲン原 子が1~3個置換していてもよいチエニルC1~6アルキル基を挙げることがで 15 きる。

ベンゾチアゾリルC1~6アルキル基としては、例えば、ベンゾチアゾールー2ーイルメチル基、ベンゾチアゾールー4ーイルメチル基、ベンゾチアゾールー5ーイルメチル基、ベンゾチアゾールー7ーイルメチル基、ベンゾチアゾールー20 7ーイルメチル基、2ー (ベンゾチアゾールー4ーイル) エチル基、(ベンゾチアゾールー5ーイル) メチル基、2ー (ベンゾチアゾールー6ーイル) エチル基、2ー (ベンゾチアゾールー7ーイル) エチル基、3ー (ベンゾチアゾールー4ーイル) プロピル基、3ー (ベンゾチアゾールー5ーイル) プロピル基、3ー (ベンゾチアゾールー7ーイル) プロピル基、4ー (ベンゾチアゾールー2ーイル) ブチル基、4ー (ベンゾチアゾールー5ーイル) ブチル基、4ー (ベンゾチアゾールー7ーイル) ブチル基、5ー (ベンゾチアゾールー7ーイル) ブチル基、5ー (ベンゾチアゾールー8ーイル) ブチル基、5ー (ベンゾチアゾールー8ーイル) ペンチル基、5ー (ベンゾチアゾールー5ーイル) ペンチル基、5ー (ベンゾチアゾールー5ーイル) ペンチル基、5ー (ベンゾチアゾールー5ーイル) ペ

ンチル基、5-(ベンゾチアゾール-6-イル)ペンチル基、5-(ベンゾチア ゾール-7-イル)ペンチル基、6-(ベンゾチアゾール-2-イル)ヘキシル 基、6-(ベンゾチアゾール-4-イル)ヘキシル基、6-(ベンゾチアゾール -5-イル)ヘキシル基、6-(ベンゾチアゾール-6-イル)ヘキシル基、6 -(ベンゾチアゾール-7-イル)ヘキシル基等を挙げることができる。

ベンゾフラン環上にハロゲン原子が置換していてもよいベンゾフリルC1~6 アルキル基としては、例えば、2-ベンゾフリルメチル基、2-(3-ベンゾフリル) エチル基、1-(4-ベンゾフリル) エチル基、3-(5-ベンゾフリル) プロピル基、4-(6-ベンゾフリル) ブチル基、5-(7-ベンゾフリ

- 10 ル)ペンチル基、6-(2-ベンゾフリル)へキシル基、2-メチル-3-(3 -ベンゾフリル)プロピル基、1,1-ジメチル-2-(2-ベンゾフリル)エ チル基、4-フルオロ-2-ベンゾフリルメチル基、5-フルオロ-2-ベンゾ フリルメチル基、6-フルオロ-2-ベンゾフリルメチル基、7-フルオロ-2 -ベンゾフリルメチル基、4-クロロ-2-ベンゾフリルメチル基、5-クロロ
- 15 -2-ベンゾフリルメチル基、6-クロロ-2-ベンゾフリルメチル基、7-クロロ-2-ベンゾフリルメチル基、4-ブロモ-2-ベンゾフリルメチル基、5-ブロモ-2-ベンゾフリルメチル基、6-ブロモ-2-ベンゾフリルメチル基、7-ブロモ-2-ベンゾフリルメチル基、4-ヨード-2-ベンゾフリルメチル基、5-ヨード-2-ベンゾフリルメチル基、6-ヨード-2-ベンゾフリルメ
- 20 チル基、7-ヨード-2ーベンゾフリルメチル基、4-フルオロ-3ーベンゾフ リルメチル基、5-フルオロ-3ーベンゾフリルメチル基、5,6ージフルオロ -2ーベンゾフリルメチル基、7-フルオロ-3ーベンゾフリルメチル基、4-クロロ-3ーベンゾフリルメチル基、3,5,6ートリクロロ-3ーベンゾフリ ルメチル基、6-クロロ-3ーベンゾフリルメチル基、7-クロロ-3ーベンゾ
- 25 フリルメチル基、4ーブロモー3ーベンゾフリルメチル基、5ーブロモー3ーベンゾフリルメチル基、6ーブロモー3ーベンゾフリルメチル基、7ーブロモー3ーベンゾフリルメチル基、5ーヨードー3ーベンゾフリルメチル基、5ーヨードー3ーベンゾフリルメチル基、7ーヨードー3ーベンゾフリルメチル基、7ーヨードー3ーベンゾフリルメチル基、7ーヨードー3ーベンゾフリルメチル基等のベンゾフラン環上に置換基としてハロゲン

原子が $1 \sim 3$ 個置換していてもよいベンゾフリル $C1 \sim 6$ アルキル基を挙げることができる。

インドリニルC1~6アルキル基(インドリン環上には、C1~6アルキル基 及びオキソ基なる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)と しては、例えば、2-インドリニルメチル基、2-(3-インドリニル)エチル 基、1-(4-インドリニル)エチル基、3-(5-インドリニル)プロピル基、 4-(6-インドリニル)ブチル基、5-(7-インドリニル)ペンチル基、6 - (1-インドリニル) ヘキシル基、2-メチル-3-(3-インドリニル)プ ロピル基、1、1-ジメチル-2-(2-インドリニル)エチル基、3、3-ジ メチルー5ーインドリニルメチル基、1、3、3ートリメチルー5ーインドリニ 10 ルメチル基、1-エチル-3,3-ジメチル-5-インドリニルメチル基、1-メチルー5ーインドリニルメチル基、1、3ージメチルー5ーインドリニルメチ ル基、1、3、3、6、7ーペンタメチルー5ーインドリニルメチル基、3、3 -ジメチル-1- (n-プロピル) -5-インドリニルメチル基、3,3-ジメ 15 チルー1ー(イソプロピル)ー5ーインドリニルメチル基、1ー(nーブチル) -3, 3-ジメチル-5-インドリニルメチル基、<math>1-(sec-ブチル)-3, 3-ジメチル-5-インドリニルメチル基、<math>1-(tert-ブチル)-3、3-ジメチル-5-インドリニルメチル基, 1- (n-ペンチル)-3, 3-ジメ チルー5ーインドリニルメチル基、1ー(nーヘキシル)-3、3ージメチルー 5-インドリニルメチル基、3、3-ジメチルー2-オキソー5-インドリニル 20 メチル基、1,3,3ートリメチルー2ーオキソー5ーインドリニルメチル基、 1-エチル-3、3-ジメチル-2-オキソー5-インドリニルメチル基、3, 3-ジメチル-2-オキソー1-(n-プロピル)-5-インドリニルメチル基、 3, 3-ジメチル-2-オキソ-1-(イソプロピル)-5-インドリニルメチ ル基、1- (n-ブチル) -3, 3-ジメチル-2-オキソ-5-インドリニル 25 メチル基、1-(sec-ブチル)-3,3-ジメチル-2-オキソ-5-イン ドリニルメチル基、1-(tert-ブチル)-3,3-ジメチル-2-オキソ -5-インドリニルメチル基、1- (n-ペンチル) -3、3-ジメチル-2-オキソー5-インドリニルメチル基、1-(n-ヘキシル)-3、3-ジメチル

-2-オキソー5-インドリニルメチル基、2-オキソー5-インドリニルメチル基等のインドリニルC1~6アルキル基(インドリン環上には、C1~6アルキル基及びオキソ基なる群より選ばれた基が1~5個置換していてもよい)を挙げることができる。

5 ベンゾオキサゾリルC1~6アルキル基(ベンゾオキサゾール環上には、ハロゲン原子、C1~6アルキル基及びオキソ基なる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、ベンゾオキサゾールー2ーイルメチル基、ベンゾオキサゾールー5ーイルメチル基、ベンゾオキサゾールー6ーイルメチル基、ベンゾオキサゾールー

10 7-イルメチル基、2-(ベンゾオキサゾール-2-イル) エチル基、1-(ベンゾオキサゾール-4-イル) エチル基、3-(ベンゾオキサゾール-5-イル) プロピル基、4-(ベンゾオキサゾール-6-イル) ブチル基、5-(ベンゾオキサゾール-7-イル) ペンチル基、6-(ベンゾオキサゾール-2-イル) ヘキシル基、2-メチル-3-(ベンゾオキサゾール-4-イル) プロピル

15 基、1、1-ジメチルー2-(ベンゾオキサゾールー5ーイル)エチル基、2、5ージメチルベンゾオキサゾールー4ーイルメチル基、2、5、6ートリメチルベンゾオキサゾールー4ーイルメチル基、4、5ージクロロベンゾオキサゾールー4ーイルメチル基、2、4、5ートリクロロベンゾオキサゾールー4ーイルメチル基、(2、3ージヒドロー2ーオキソーベンゾオキサゾールー3ーイル)メチル基、(2、3ージヒドロー2ーオキソーベンゾオキサゾールー3ーイル)メ

20 チル基、(2,3-ジヒドロ-2-オキソーベンゾオキサゾール-4-イル)メ チル基、(2,3-ジヒドロ-2-オキソーベンゾオキサゾール-5-イル)メ チル基、(2,3-ジヒドロ-2-オキソーベンゾオキサゾール-6-イル)メ チル基、(2,3-ジヒドロ-2-オキソーベンゾオキサゾール-7-イル)メ チル基、2-(ベンゾオキサゾール-4-イル)エチル基、(ベンゾオキサゾー

25 ルー5ーイル)メチル基、2ー(ベンゾオキサゾールー6ーイル)エチル基、2 ー(ベンゾオキサゾールー7ーイル)エチル基、2ー(2,3ージヒドロー2ー オキソーベンゾオキサゾールー3ーイル)エチル基、2ー(2,3ージヒドロー 2ーオキソーベンゾオキサゾールー4ーイル)エチル基、2ー(2,3ージヒドロー ロー2ーオキソーベンゾオキサゾールー5ーイル)エチル基、2ー(2,3ージ

ージヒドロー2ーオキソーベンゾオキサゾールー7ーイル) エチル基、3ー(ベ ンゾオキサゾールー2ーイル)プロピル基、3-(ベンゾオキサゾールー4ーイ ル)プロピル基、3-(ベンゾオキサゾール-6-イル)プロピル基、3-(ベ ンゾオキサゾールー7ーイル)プロピル基、3-(2,3-ジヒドロー2-オキ ソーベンゾオキサゾールー3ーイル)プロピル基、3-(2,3-ジヒドロ-2 ーオキソーベンブオキサゾールー4ーイル)プロピル基、3-(2,3-ジヒド ロー2ーオキソーベンゾオキサゾールー5ーイル)プロピル基、3ー(2,3-ジヒドロー2-オキソーベンゾオキサゾール-6-イル)プロピル基、3-(2. 3 - ジヒドロー2 - オキソーベンゾオキサゾールー7 - イル)プロピル基、4-10 (ベンゾオキサゾールー2ーイル) ブチル基、4-(ベンゾオキサゾールー4-イル) ブチル基、4-(ベンゾオキサゾール-5-イル) ブチル基、4-(ベン ゾオキサゾールー7ーイル)ブチル基、4-(2,3-ジヒドロー2-オキソー ベンゾオキサゾールー3ーイル) ブチル基、4-(2,3-ジヒドロ-2-オキ ソーベンゾオキサゾールー4ーイル)ブチル基、4-(2,3-ジヒドロー2-15 オキソーベンゾオキサゾールー5ーイル)ブチル基、4ー(2,3ージヒドロー 2-オキソーベンゾオキサゾールー6-イル) ブチル基、4-(2,3-ジヒド ロー2ーオキソーベンゾオキサゾールー7ーイル)ブチル基、5ー(ベンゾオキ サゾール-2-イル)ペンチル基、5-(ベンゾオキサゾール-4-イル)ペン チル基、5-(ベンゾオキサゾール-5-イル)ペンチル基、5-(ベンゾオキ 20 サゾールー6ーイル)ペンチル基、5ー(2,3-ジヒドロー2ーオキソーベン ゾオキサゾールー3ーイル)ペンチル基、5-(2,3-ジヒドロ-2-オキソ ーベンブオキサゾールー4ーイル)ペンチル基、5-(2,3-ジヒドロ-2-オキソーベンブオキサゾールー5ーイル)ペンチル基、5ー(2、3ージヒドロ - 2-オキソーベンゾオキサゾール-6-イル)ペンチル基、5-(2、3-ジ 25ヒドロー2ーオキソーベンゾオキサゾールー7ーイル)ペンチル基、6ー(ベン ゾオキサゾールー4ーイル) ヘキシル基、6-(ベンゾオキサゾール-5-イ ル) ヘキシル基、6- (ベンゾオキサゾール-6-イル) ヘキシル基、6- (ベ ンゾオキサゾールー7ーイル)へキシル基、6-(2,3-ジヒドロー2ーオキ

ソーベンゾオキサゾールー3ーイル)へキシル基、6-(2,3-ジヒドロー2 -オキソーベンゾオキサゾールー4-イル) ヘキシル基、6-(2,3-ジヒド ロー2ーオキソーベンゾオキサゾールー5ーイル)へキシル基、6ー(2,3-ジヒドロ-2-オキソーベンゾオキサゾール-6-イル)へキシル基、6-(2, 3-ジヒドロ-2-オキソーベンゾオキサゾール-7-イル)へキシル基、2-メチルベンゾオキサゾールー4ーイルメチル基、2ーメチルベンゾオキサゾール -5-イルメチル基、2-メチルベンゾオキサゾール-6-イルメチル基、4-メチルベンゾオキサゾール-2-イルメチル基、5-メチルベンゾオキサゾール - 2イルメチル基、6-メチルベンゾオキサゾール-2-イルメチル基、7-メ チルベンゾオキサゾールー2ーイルメチル基、2ーエチルベンゾオキサゾールー 10 4-イルメチル基、2-エチルベンゾオキサゾール-5-イルメチル基、2-エ チルベンゾオキサゾールー6-イルメチル基、2-n-プロピルベンゾオキサゾ ールー4ーイルメチル基、2-n-プロピルベンブオキサゾールー5-イルメチ ル基、2-n-プロピルベンゾオキサゾール-6-イルメチル基、4-フルオロ ベンゾオキサゾールー2-イルメチル基、5-フルオロー2-ベンゾオキサゾリ 15 ルメチル基、6-フルオロ-2-ベンゾオキサゾリルメチル基、7-フルオロベ ンゾオキサゾール-2-イルメチル基、4-クロロベンゾオキサゾール-2-イ ルメチル基、5-クロロ-2-ベンゾオキサゾール-2-イルメチル基、6-ク ロロー2-ベンゾオキサゾール-2-イルメチル基、7-クロロー2-ベンゾオ キサゾールー2ーイルメチル基、4ーブロモー2ーベンゾオキサゾールー2ーイ 20 ルメチル基、5-ブロモ-2-ベンゾオキサゾール-2-イルメチル基、6-ブ ロモー2ーベンゾオキサゾールー2ーイルメチル基、7ーブロモー2ーベンゾオ キサゾール-2-イルメチル基、4-フルオロ-2-オキソ-2,3-ジヒドロ ベンゾオキサゾール-3-イルメチル基、5-フルオロ-2-オキソー2,3-ジヒドロベンゾオキサゾールー3ーイルメチル基、6ーフルオロー2ーオキソー 25 2, 3-ジヒドロベンブオキサゾール-3-イルメチル基、7-フルオロ-2-オキソー2, 3ージヒドロベンゾオキサゾールー3ーイルメチル基、4ークロロ -2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンブオキサゾール-3-イルメチル基、5-クロロ-2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-3-イルメチル基、

6-クロロー2-オキソー2、3-ジヒドロベンブオキサゾールー3-イルメチ ル基、7-クロロー2-オキソー2、3-ジヒドロベンゾオキサゾールー3-イ ルメチル基、4ーブロモー2ーオキソー2、3ージヒドロベンゾオキサゾールー 3-イルメチル基、5-ブロモー2-オキソー2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾ - 一ルー3ーイルメチル基、6-ブロモー2-オキソー2,3-ジヒドロベンゾオ キサゾールー3ーイルメチル基、7ーブロモー2ーオキソー2、3ージヒドロベ ンゾオキサゾールー3ーイルメチル基、4ーフルオロー2ーオキソー2.3ージ ヒドロベンブオキサゾールー5ーイルメチル基、5ーフルオロー2ーオキソー2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-5-イルメチル基、6-フルオロ-2-オキ ソー2,3-ジヒドロベンゾオキサゾールー5-イルメチル基、7-フルオロー 10 2-オキソー2,3-ジヒドロベンゾオキサゾールー5-イルメチル基、4-ク ロロー2ーオキソー2, 3ージヒドロベンゾオキサゾールー5ーイルメチル基、 5-クロロー2-オキソー2、3-ジヒドロベンゾオキサゾールー5-イルメチ ル基、6-クロロー2-オキソー2、3-ジヒドロベンブオキサブールー5-イ 15 ルメチル基、7ークロロー2ーオキソー2、3ージヒドロベンゾオキサゾールー 5ーイルメチル基、4ーブロモー2ーオキソー2、3ージヒドロベンゾオキサゾ ールー5ーイルメチル基、5ーブロモー2ーオキソー2,3ージヒドロベンゾオ キサゾールー5ーイルメチル基、6ーブロモー2ーオキソー2、3ージヒドロベ ンゾオキサゾールー5-イルメチル基、7-ブロモー2-オキソー2,3-ジヒ 20 ドロベンゾオキサゾールー5ーイルメチル基、4ーフルオロー2ーオキソー2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-6-イルメチル基、5-フルオロ-2-オキ ソー2,3-ジヒドロベンゾオキサゾールー6-イルメチル基、6-フルオロー 2-オキソー2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾールー6-イルメチル基、7-フ ルオロー2ーオキソー2, 3ージヒドロベンゾオキサゾールー6ーイルメチル基、 4-クロロ-2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-6-イルメチ 25ル基、5-クロロ-2-オキソ-2、3-ジヒドロベンゾオキサゾール-6-イ ルメチル基、6-クロロ-2-オキソ-2、3-ジヒドロベンゾオキサゾールー 6-イルメチル基、7-クロロー2-オキソー2、3-ジヒドロベンゾオキサゾ ールー6ーイルメチル基、4ーブロモー2ーオキソー2,3ージヒドロベンゾオ

キサゾールー6ーイルメチル基、5ーブロモー2ーオキソー2,3ージヒドロベンゾオキサゾールー6ーイルメチル基、6ーブロモー2ーオキソー2,3ージヒドロベンゾオキサゾールー6ーイルメチル基、7ーブロモー2ーオキソー2,3ージヒドロベンゾオキサゾールー6ーイルメチル基等のベンゾオキサゾリルC1~6アルキル基(ベンゾオキサゾール環上には、ハロゲン原子、C1~6アルキル基及びオキソ基なる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

クロメニルC1~6アルキル基としては、例えば、2-クロメニルメチル基、3-クロメニルメチル基、4-クロメニルメチル基、5-クロメニルメチル基、10 6-クロメニルメチル基、7-クロメニルメチル基、8-クロメニルメチル基、2-(2-クロメニル) エチル基、1-(3-クロメニル) エチル基、3-(4-クロメニル) プロピル基、4-(5-クロメニル) ブチル基、5-(6-クロメニル) ペンチル基、6-(7-クロメニル) ヘキシル基、2-メチルー3-(8-クロメニル) プロピル基、1,1ージメチルー2-(6-クロメニル) エチル基等を挙げることができる。

1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリルC1~6アルキル基(キノリン環上に は、Cl~6アルキル基及びオキソ基なる群より選ばれた基の少なくとも1種が 置換していてもよい)としては、例えば、(1,2,3,4ーテトラヒドロー6 ーキノリル)メチル基、2-(1,2,3,4-テトラヒドロー2-キノリル) 20 - エチル基、1-(1,2,3,4-テトラヒドロ-1-キノリル)エチル基、3 - (1, 2, 3, 4-テトラヒドロー3-キノリル)プロピル基、4-(1, 2, 3, 4-テトラヒドロー4-キノリル) ブチル基、5-(1, 2, 3, 4-テト - ラヒドロー5ーキノリル)ペンチル基、6ー(1, 2, 3, 4ーテトラヒドロー 6-キノリル) ヘキシル基、2-メチル-3-(1,2,3,4-テトラヒドロ - - 7 - キノリル)プロピル基、1、1 - ジメチルー2- (1,2,3,4-テト 25 ラヒドロー8ーキノリル) エチル基、2-オキソー1,2,3,4-テトラヒド u-6-+ノリルメチル基、4-メチル-1, 2, 3, 4-テトラヒドu-6-キノリルメチル基、4ーオキソー1,2,3,4ーテトラヒドロー6ーキノリル メチル基、4,6-ジメチル-1,2,3,4-テトラヒドロー5-キノリルメ

チル基、1,4,8-トリメチル-1,2,3,4-テトラヒドロー6-キノリ ルメチル基、1-メチル-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロ-6-キ ノリルメチル基、1-エチル-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロー6 -キノリルメチル基、2-オキソ-1- (n-プロピル) -1, 2, 3, 4-テ トラヒドロー6ーキノリルメチル基、2-オキソー1-(イソプロピル)-1, 5 2, 3, 4-テトラヒドロー6-キノリルメチル基、1-(n-ブチル)-2-オキソー1, 2, 3, 4ーテトラヒドロー6ーキノリルメチル基、1ー(sec ーブチル) -2-オキソー1, 2, 3, 4-テトラヒドロー6ーキノリルメチル 基, 1-(tert-ブチル)-2-オキソー1, 2, 3, 4-テトラヒドロー 6-キノリルメチル基, 1-(n-ペンチル)-2-オキソー1,2,3,4-10 テトラヒドロー6-キノリルメチル基, 1- (n-ヘキシル)-2-オキソー1, 2、3、4ーテトラヒドロー6ーキノリルメチル基、2-(2-オキソー1,2, 3, 4ーテトラヒドロー6ーキノリル) エチル基、3ー(2ーオキソー1, 2, 3, 4ーテトラヒドロー6ーキノリル)プロピル基、4ー(2ーオキソー1, 2, 3、4-テトラヒドロー6-キノリル) ブチル基、5-(2-オキソー1, 2, 15 3, 4ーテトラヒドロー6ーキノリル)ペンチル基、6ー(2ーオキソー1, 2, 3, 4ーテトラヒドロー6ーキノリル) ヘキシル基、2ー(1ーメチルー2ーオ キソー1, 2, 3, 4ーテトラヒドロー6ーキノリル) エチル基、3ー(1ーメ チルー2ーオキソー1,2,3,4ーテトラヒドロー6ーキノリル)プロピル基、 4-(1-メチル-2-オキソー1,2,3,4-テトラヒドロー6-キノリ 20 ル) ブチル基、5-(1-メチル-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロ -6-キノリル)ペンチル基、6-(1-メチル-2-オキソー1, 2, 3, 4ーテトラヒドロー6ーキノリル) ヘキシル基等の1,2,3,4ーテトラヒドロ キノリルC1~6アルキル基(キノリン環上には、C1~6アルキル基及びオキ ソ基なる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい)を挙げることができ 25チアゾリルC1~6アルキル基 (チアゾール環上には、ハロゲン原子、ハ る。 ロゲン置換もしくは未置換のフェニル基及びC1~6アルキル基からなる群より 選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、2-チ アゾリルメチル基、4ーチアゾリルメチル基、5ーチアゾリルメチル基、2ー

(2-チアゾリル) エチル基、1-(4-チアゾリル) エチル基、3-(5-チ アゾリル)プロピル基、4-(2-チアゾリル)ブチル基、5-(4-チアゾリ ル)ペンチル基、6-(5-チアゾリル)へキシル基、2-メチル-3-(2-チアゾリル)プロピル基、1、1-ジメチル-2-(4-チアゾリル)エチル基、 2-クロロー4-チアゾリルメチル基、2,5-ジクロロー4-チアゾリルメチ ル基、2-クロロー5-チアゾリルメチル基、2-クロロー6-チアゾリルメチ ル基、6-クロロ-2-チアゾリルメチル基、5-クロロ-2-チアゾリルメチ ル基、4ークロロー2ーチアゾリルメチル基、5ークロロー4ーチアゾリルメチ ル基、4ークロロー5ーチアゾリルメチル基、2ーエチルー4ーチアゾリルメチ 10 ル基、2,5-ジメチルー4-チアゾリルメチル基2-メチルー4-チアゾリル メチル基、2ーメチルー5ーチアゾリルメチル基、2ーメチルー6ーチアゾリル メチル基、6-メチル-2-チアゾリルメチル基、5-メチル-2-チアゾリル メチル基、4ーメチルー2ーチアゾリルメチル基、5ーメチルー4ーチアゾリル メチル基、4ーメチルー5ーチアゾリルメチル基、2ーエチルー4ーチアゾリル メチル基、2-エチル-5-チアゾリルメチル基、2-エチル-6-チアゾリル メチル基、6-エチル-2-チアゾリルメチル基、5-エチル-2-チアゾリル メチル基、4ーエチルー2ーチアゾリルメチル基、5ーエチルー4ーチアゾリル メチル基、4ーエチルー5ーチアゾリルメチル基、2ーフェニルー4ーチアゾリ ルメチル基、2-フェニル-5-チアゾリルメチル基、2-フェニル-6-チア ゾリルメチル基、6-フェニルー2ーチアゾリルメチル基、5-フェニルー2-20 チアゾリルメチル基、4-フェニル-2-チアゾリルメチル基、5-フェニルー 4ーチアゾリルメチル基、4ーフェニルー5ーチアゾリルメチル基、5ー(2ー フルオロフェニル) -2-チアゾリルメチル基、5-(2,4-ジフルオロフェ ニル) -4-チアゾリルメチル基、4-(2-フルオロフェニル) -5-チアゾ リルメチル基、2- (2-フルオロフェニル)- 4-チアゾリルメチル基、2-25(2-フルオロフェニル) -5-チアゾリルメチル基、2-(3-フルオロフェ ニル) -4-チアゾリルメチル基、2- (3-フルオロフェニル) -5-チアゾ リルメチル基、2-(4-フルオロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、4-(2-フルオロフェニル) -5-チアゾリルメチル基、2-(2-クロロフェニ

テトラゾリルC1~6アルキル基(テトラゾール環上には、ハロゲン置換もし くは未置換のフェニル基及びC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基の少 なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、5-(1H)ーテトラ ゾリルメチル基、2- (5- (1 H) - テトラゾリル)エチル基、1- (5-(1H) ーテトラゾリル) エチル基、3-(5-(1H) ーテトラゾリル) プロ ピル基、4-(5-(1H)-テトラゾリル)ブチル基、5-(5-(1H)-テトラブリル)ペンチル基、6-(5-(1H)-テトラブリル)へキシル基、 2-メチル-3-(5-(1H)-テトラゾリル)プロピル基、1, 1-ジメチ ルー2- (5- (1H) ーテトラゾリル) エチル基、1-メチルー5- (1H) ーテトラゾリルメチル基、1-エチル-5-(1H) ーテトラゾリルメチル基、 1-プロピル-5-(1H) -テトラゾリルメチル基、1-ブチル-5-(1 H) ーテトラゾリルメチル基、1-ペンチル-5-(1H) ーテトラゾリルメチ ル基、1 - ヘキシルー 5 - (1 H) - テトラゾリルメチル基、1 - フェニル - 5 20 (1H) ーテトラゾリルメチル基、1-(2-フルオロフェニル)-5-(1 H) -テトラブリルメチル基、1-(3-フルオロフェニル) - 5-(1H) -テトラゾリルメチル基、1-(2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニル) -5-(1H) ーテトラゾリルメチル基、1-(2-クロロフェニル) -5-(1H) ーテトラゾリルメチル基、1-(3-2)ロロフェニル)-5-(1H)25ーテトラゾリルメチル基、1-(2,4,6-トリクロロフェニル)-5-(1 H) -テトラゾリルメチル基、1-(2-)ロモフェニル) -5-(1H) -テ トラゾリルメチル基、1-(2,3-ジブロモフェニル)-5-(1H)-テト

ラゾリルメチル基、1-(4-ブロモフェニル)-5-(1H)-テトラゾリル

メチル基、2-(1-メチル-5-(1H)-テトラゾリル)エチル基、2-(1-エチル-5-(1H)ーテトラゾリル)エチル基、2-(1-プロピル-5- (1H) -テトラゾリル) エチル基、2- (1-ブチル-5- (1H) -テ トラゾリル) エチル基、2- (1-ペンチル-5- (1H) ーテトラゾリル) エ チル基、2-(1-ヘキシル-5-(1H)-テトラゾリル)エチル基、2-(1-フェニル-5-(1H)ーテトラゾリル)エチル基、2-(1-(2-フ ルオロフェニル) -5- (1H) -テトラゾリル) エチル基、2- (1- (3-フルオロフェニル) -5- (1H) -テトラゾリル) エチル基、2- (1- (4 ーフルオロフェニル) - 5 - (1 H) -テトラゾリル) エチル基、2 - (1 -(2-クロロフェニル) -5- (1H) -テトラゾリル) エチル基、2- (1-10 (3-クロロフェニル) -5- (1H) -テトラゾリル) エチル基、2- (1-(4ークロロフェニル) -5- (1H) -テトラゾリル) エチル基、2- (1-(2-ブロモフェニル) -5- (1H) -テトラゾリル) エチル基、2- (1-(3-ブロモフェニル) -5- (1H) -テトラゾリル) エチル基、2- (1-(4-ブロモフェニル) -5- (1H) -テトラゾリル) エチル基等のテトラゾ 15 リルC1~6アルキル基(テトラゾール環上には、ハロゲン原子が1~5個置換 もしくは未置換のフェニル基及びC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基 が置換していてもよい)を挙げることができる。

R³²及びR³³が隣接する窒素原子と共に他の炭素原子を介して互いに結合 10で形成するピペリジン環又は1,2,3,6ーテトラヒドロピリジン環(ピペリジン環及び1,2,3,6ーテトラヒドロピリジン環上には、フェニル基が置換してもよく、該フェニル基にはハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。)としては、例えば、ピペリジン、4ーフェニルピペリジン、4ー(2ーフルオロフェニル)ピペリジン、4ー(3ーフルオロフェニル)ピペリジン、4ー(3ーフルオロフェニル)ピペリジン、4ー(3,4,5ートリクロロフェニル)ピペリジン、4ー(2,3,4,5)6ーペンタフルオロフェニル)ピペリジン、4ー(2,4ージメチルフェニル)ピペリジン、4ー(2,4-「2ートリリジン、4ー(2,4,6ートリメチルフェニル)ピペリジン、4ー(2ートリリジン、4ー(2,4,6ートリメチルフェニル)ピペリジン、4ー(2ートリ

フルオロメチルー4ーメチルフェニル)ピペリジン、4ー(4ーフルオロフェニ ル) ピペリジン、4-(3,4-ジフルオロフェニル) ピペリジン、4-(2-クロロフェニル)ピペリジン、4-(3-クロロフェニル)ピペリジン、4-(4ークロロフェニル)ピペリジン、4ー(3,4ージクロロフェニル)ピペリ ジン、4-(2-メチルフェニル)ピペリジン、4-(3-メチルフェニル)ピ ペリジン、4-(4-メチルフェニル)ピペリジン、4-(2-トリフルオロメ チルフェニル) ピペリジン、4-(3-トリフルオロメチルフェニル) ピペリジ ン、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペリジン、4-フェニルー1. 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン、、4-(2-フルオロフェニル) -1. 2. 10 3, 6ーテトラヒドロピリジン、4ー(3ーフルオロフェニル)-1, 2, 3, 6ーテトラヒドロピリジン、4ー(4ーフルオロフェニル)-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン、4-(3, 4-i)フルオロフェニル) -1, 2, 3, 6ーテトラヒドロピリジン、4-(2-クロロフェニル)-1,2,3,6-テト ラヒドロピリジン、4-(3-クロロフェニル)-1,2,3,6-テトラヒド 15 ロピリジン、4ー(4ークロロフェニル)-1,2,3,6-テトラヒドロピリ ジン、4-(3, 4-i)クロロフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリ ジン、4-(2-メチルフェニル)-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン、 4-(3-メチルフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン、<math>4-(4-メチルフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン、4- (2-20 トリフルオロメチルフェニル) -1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン、4-(3-トリフルオロメチルフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン、 4-(4-)リフルオロメチルフェニル) -1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリ ジン、4ー(3-フルオロー4-トリフルオロメチルフェニル)-1,2,3. 6-テトラヒドロピリジン、4-(3, 4, 5-トリクロロフェニル)-1, 2,3, 6ーテトラヒドロピリジン、4ー(2, 3, 4, 5, 6ーペンタフルオロフ 25 ェニル) -1, 2, 3, 6 - テトラヒドロピリジン、4 - (2, 4 - ジメチルフ x=2 x=2チルフェニル) -1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン、4-(2-トリフル オロメチルー4ーメチルフェニル) -1, 2, 3, 6ーテトラヒドロピリジン等

C3~8シクロアルケニル基としては、例えば、シクロプロペニル基、シクロブテニル基、シクロペンテニル基、シクロヘキセニル基、シクロヘプテニル基、シクロオクテニル基等を挙げることができる。

フェニル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基、 C1~4アルキレンジオキシ基、C1~6アルキルスルホニル基、ハロゲン置換 もしくは未置換のC1~6アルキルチオ基、ニトロ基及び置換基としてC1~6 アルカノイル基を有することのあるアミノ基からなる群より選ばれた基の少なく とも1種が $1\sim5$ 個置換していてもよい]としては、例えば、フェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-15 クロロフェニル基、3ークロロフェニル基、4ークロロフェニル基、2ープロモ フェニル基、3-ブロモフェニル基、4-ブロモフェニル基、2-ヨードフェニ ル基、3-ヨードフェニル基、4-ヨードフェニル基、2,3-ジフルオロフェ ニル基、3,4ージフルオロフェニル基、3,5ージフルオロフェニル基、2, 4ージフルオロフェニル基、2,6ージフルオロフェニル基、2,3ージクロロ 20 フェニル基、3,4ージクロロフェニル基、3,5ージクロロフェニル基、2, 4-ジクロロフェニル基、2,6-ジクロロフェニル基、3,4,5-トリフル オロフェニル基、3,4,5ートリクロロフェニル基、2,4,6ートリフルオ ロフェニル基、2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニル基、2,4,6-トリクロロフェニル基、2-メチルフェニル基、3-メチルフェニル基、4-メ 25 チルフェニル基、2, 4-ジメチルフェニル基、2, 4, 6-トリメチルフェニ ル基、2-メチルー3-クロロフェニル基、3-メチルー4-クロロフェニル基、 2-クロロー4-メチルフェニル基、2-メチル-3-フルオロフェニル基、2

ートリフルオロメチルフェニル基、3ートリフルオロメチルフェニル基、4ート

リフルオロメチルフェニル基、2ーペンタフルオロエチルフェニル基、3ーペン タフルオロエチルフェニル基、4ーペンタフルオロエチルフェニル基、2ーイソ プロピルフェニル基、3-イソプロピルフェニル基、4-イソプロピルフェニル 基、2-tert-ブチルフェニル基、3-tert-ブチルフェニル基、4tert-ブチルフェニル基、2-sec-ブチルフェニル基、3-sec-ブ チルフェニル基、4-sec-ブチルフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロ ピルフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-n-ヘプタ フルオロプロピルフェニル基、4ーペンチルフェニル基、4-ヘキシルフェニル 基、2-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、4-メトキシフェニル 基、2ーメトキシー3ークロロフェニル基、2ーフルオロー3ーメトキシフェニ 10 ル基、2-フルオロー4-メトキシフェニル基、2,6-ジメトキシフェニル基、 2.4.6-トリメトキシフェニル基、2,3,4-トリフルオロフェニル基、 3、4、5-トリフルオロフェニル基、2-トリフルオロメトキシフェニル基、 3-トリフルオロメトキシフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基、 2-ペンタフルオロエトキシフェニル基、3-ペンタフルオロエトキシフェニル 15 基、4ーペンタフルオロエトキシフェニル基、2ーイソプロポキシフェニル基、 3-イソプロポキシフェニル基、4-イソプロポキシフェニル基、2-tert ーブトキシフェニル基、3-tertーブトキシフェニル基、4-tertーブ トキシフェニル基、2-sec-ブトキシフェニル基、3-sec-ブトキシフ ェニル基、4-sec-ブトキシフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロポキ 20 シフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-n-ヘプタ フルオロプロポキシフェニル基、4ーペントキシフェニル基、4ーヘキシルオキ シフェニル基、2、3-メチレンジオキシフェニル基、3,4-メチレンジオキ シフェニル基、3-ニトロフェニル基、2、3-ジニトロフェニル基、2、4、 6-トリニトロフェニル基、4-ニトロフェニル基、3-メチルチオフェニル基、 25 4-メチルチオフェニル基、3-トリフルオロメチルチオフェニル基、4-トリ フルオロメチルチオフェニル基、3-メタンスルホニルフェニル基、4-メタン スルホニルフェニル基、2-メタンスルホニルフェニル基、2-アミノフェニル、 2, 4-ジアミニフェニル、2, 4, 6-トリアミノフェニル、2-アセチルア

ミノフェニル基、3ーアセチルアミノフェニル基、4ーアセチルアミノフェニル 基等のフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ 基、C1~4アルキレンジオキシ基、C1~6アルキルスルホニル基、ハロゲン 置換もしくは未置換のC1~6アルキルチオ基、ニトロ基及び置換基としてC1~6アルカノイル基1~2個を有することのあるアミノ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい。置換基がC1~4アルキレンジオキシ基の場合は、1~3個置換するのがよい。]を挙げることができる。

- ベンゾフリル基 [ベンゾフラン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしく 10 は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アル コキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]と しては、例えば、無置換の2-ベンゾフリル基、4-フルオロー2-ベンゾフリ ル基、5-フルオロー2ーベンゾフリル基、6-フルオロー2ーベンゾフリル基、 7-フルオロー2-ベンゾフリル基、4-クロロー2-ベンゾフリル基、5-ク 15 ロロー2-ベンゾフリル基、6-クロロー2-ベンゾフリル基、7-クロロー2 ーベンゾフリル基、4ーブロモー2ーベンゾフリル基、5ーブロモー2ーベンゾ フリル基、6-ブロモー2-ベンゾフリル基、7-ブロモー2-ベンゾフリル基、 4-メチル-2-ベンゾフリル基、5-メチル-2-ベンゾフリル基、6-メチ ルー2-ベンゾフリル基、7-メチルー2-ベンゾフリル基、4-トリフルオロ 20 メチルー2-ベンゾフリル基、5-トリフルオロメチルー2-ベンゾフリル基、 6-トリフルオロメチルー2-ベンゾフリル基、7-トリフルオロメチルー2-ベンゾフリル基、4-エチル-2-ベンゾフリル基、5-エチル-2-ベンゾフ リル基、6-エチルー2-ベンゾフリル基、7-エチルー2-ベンゾフリル基、
- 25 4ーペンタフルオロエチルー2ーベンゾフリル基、5ーペンタフルオロエチルー 2ーベンゾフリル基、6ーペンタフルオロエチルー2ーベンゾフリル基、7ーペ ンタフルオロエチルー2ーベンゾフリル基、4ーメトキシー2ーベンゾフリル基、 5ーメトキシー2ーベンゾフリル基、6ーメトキシー2ーベンゾフリル基、7ー メトキシー2ーベンゾフリル基、4ートリフルオロメトキシー2ーベンゾフリル

基、5ートリフルオロメトキシー2ーベンゾフリル基、6ートリフルオロメトキ シー2ーベンゾフリル基、7ートリフルオロメトキシー2ーベンゾフリル基、4 ーイソプロピルー2ーベンゾフリル基、5-イソプロピルー2ーベンゾフリル基、 6ーイソプロピルー2ーベンゾフリル基、7ーイソプロピルー2ーベンゾフリル 基、4-ヘキシルー2-ベンゾフリル基、5-ヘキシルー2-ベンゾフリル基、 6-ヘキシルー2-ベンゾフリル基、7-ヘキシルー2-ベンゾフリル基、4-エトキシー2-ベンゾフリル基、5-エトキシー2-ベンゾフリル基、6-エト キシー2ーベンゾフリル基、7ーエトキシー2ーベンゾフリル基、4ーフルオロ - 5 - トリフルオロメチル- 2 - ベンゾフリル基、6 - フルオロー5 - トリフル オロメチルー2ーベンゾフリル基、7ーフルオロー5ートリフルオロメチルー2 10 ーベンゾフリル基、4ークロロー5ートリフルオロメチルー2ーベンゾフリル基、 6-クロロー5ートリフルオロメチルー2ーベンゾフリル基、7ークロロー5ー トリフルオロメチルー2-ベンゾフリル基、4-クロロ-5-トリフルオロメト キシー2ーベンゾフリル基、6ークロロー5ートリフルオロメトキシー2ーベン - ゾフリル基、7ークロロー5ートリフルオロメトキシー2ーベンゾフリル基、3 15 ーベンゾフリル基、4-フルオロ-3-ベンゾフリル基、5-フルオロ-3-ベ ンゾフリル基、6-フルオロー3-ベンゾフリル基、7-フルオロー3-ベンゾ フリル基、4-クロロー3-ベンゾフリル基、5-クロロー3-ベンゾフリル基、 6-クロロー3-ベンゾフリル基、7-クロロー3-ベンゾフリル基、4-ブロ モー3-ベンゾフリル基、5-ブロモー3-ベンゾフリル基、6-ブロモー3-20 ベンゾフリル基、7ーブロモー3ーベンゾフリル基、4ーメチルー3ーベンゾフ リル基、5-メチルー3-ベンゾフリル基、6-メチルー3-ベンゾフリル基、 7-メチル-3-ベンゾフリル基、4-トリフルオロメチル-3-ベンゾフリル 基、5-トリフルオロメチル-3-ベンゾフリル基、6-トリフルオロメチル-3-ベンゾフリル基、7-トリフルオロメチル-3-ベンゾフリル基、4-エチ 25 ルー3-ベンゾフリル基、5-エチルー3-ベンゾフリル基、6-エチルー3-ベンゾフリル基、7-エチルー3-ベンゾフリル基、4-ペンタフルオロエチル - 3 - ベンゾフリル基、5 - ペンタフルオロエチル-3 - ベンゾフリル基、6 -ペンタフルオロエチルー3ーベンゾフリル基、7ーペンタフルオロエチルー3ー

ベンゾフリル基、4-メトキシ-3-ベンゾフリル基、5-メトキシ-3-ベン ゾフリル基、6-メトキシ-3-ベンゾフリル基、7-メトキシ-3-ベンゾフ リル基、4ートリフルオロメトキシー3ーベンゾフリル基、5ートリフルオロメ トキシー3-ベンゾフリル基、6-トリフルオロメトキシー3-ベンゾフリル基、 7-トリフルオロメトキシー3-ベンゾフリル基、4-イソプロピルー3-ベン ゾフリル基、5ーイソプロピルー3ーベンゾフリル基、6ーイソプロピルー3ー ベンゾフリル基、7ーイソプロピルー3ーベンゾフリル基、4ーヘキシルー3ー ベンゾフリル基、5-ヘキシル-3-ベンゾフリル基、6-ヘキシル-3-ベン ゾフリル基、7-ヘキシル-3-ベンゾフリル基、4-エトキシ-3-ベンゾフ リル基、5-エトキシー3-ベンゾフリル基、6-エトキシー3-ベンゾフリル 10 基、7-エトキシー3-ベンゾフリル基、4-フルオロー5-トリフルオロメチ ルー3-ベンゾフリル基、6-フルオロー5-トリフルオロメチルー3-ベンゾ フリル基、7-フルオロー5-トリフルオロメチルー3-ベンゾフリル基、4-クロロー5ートリフルオロメチルー3ーベンゾフリル基、6ークロロー5ートリ フルオロメチルー3ーベンゾフリル基、7ークロロー5ートリフルオロメチルー 15 3-ベンゾフリル基、4-クロロ-5-トリフルオロメトキシ-3-ベンゾフリ ル基、6-クロロー5-トリフルオロメトキシー3-ベンゾフリル基、6、7-ジクロロー5-トリフルオロメトキシー3-ベンゾフリル基、5,6、7-トリ クロロー2ーベンゾフリル基、7ークロロー5ートリフルオロメトキシー3ーベ ンゾフリル基等のベンゾフリル基 [ベンゾフラン環上にハロゲン原子、ハロゲン 20 置換もしくは未置換のC1~6アルキル及びハロゲン置換もしくは未置換のC1 ~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい]を 挙げることができる。

フリル基 [フラン環上には、置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル基が置換していてもよい。] としては、例えば、2-フリル基、3,5-ジフェニル-2-フリル基、2,4,5-トリフェニル-3-フリル基、5-(4-クロロフェニル)-2-フリル基、4-(4-フルオロフェニル)-2-フリル基、4-(2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニル)-2-フリル基、3-(4-ブロモフェニル)-2-フリル基、3-フリル基、5-(2,4

-ジクロロフェニル) -3-フリル基、4-(2, 4, 6-トリクロロフェニル) -3-フリル基、3-(4-ヨードフェニル) -3-フリル基等のフリル基 [フラン環上には、置換基としてハロゲン原子1~5個有することのあるフェニル基が1~3個置換していてもよい。] を挙げることができる。

5 フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子:ハロゲン置換もしくは未置換 のC1~6のアルキル基;C3~8シクロアルキル基;ヒドロキシル基;ハロゲ ン置換もしくは未置換のС1~8のアルコキシ基;С3~8シクロアルコキシ 基:C1~4アルキレンジオキシ基;シアノ基;ニトロ基:フェニルC2~6ア ルケニル基; C2~6アルカノイルオキシ基;置換基としてC1~6アルカノイ 10 ル基を有することのあるアミノ基: C1~6アルキルスルホニルアミノ基: フェ ニルC1~6アルコキシ基;フェノキシ基;C1~6アルキル基が少なくとも1 個置換したアミノ基:フェニル基が少なくとも1個置換したアミノ基;アミノC 1~6アルコキシ基 [アミノ基上には、C1~6アルキル基が少なくとも1個置 換していてもよい];C1~6アルコキシカルボニル基;C1~6アルコキシカ 15 ルボニルC1~6アルコキシ基;C1~6アルキルチオ基;ピロリル基;イミダー ブリル基;ピペリジル基;モルホリノ基;ピロリジニル基;チエニル基;ベンゾ フリル基:ピペラジニル基[ピペラジン環上には、置換基としてC1~6アルキ ル基、フェニルC1~6アルキル基及びC1~6アルキル基を少なくとも1種有 することのあるベンゾイル基からなる群より選ばれた基が少なくとも1種置換し ていてもよい];キノリル基[キノリン環上にC1~6アルコキシ基及びオキソ 20 基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] ;ピペリ ジン環上にカルボスチリル基が置換していてもよいピペリジルカルボニル基及び トリアゾリル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよ い)としては、例えば、フェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフ ェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニ 25 ル基、4ークロロフェニル基、2ーブロモフェニル基、3ーブロモフェニル基、 4-ブロモフェニル基、2-ヨードフェニル基、3-ヨードフェニル基、4-ヨ ードフェニル基、2、3ージフルオロフェニル基、3、4ージフルオロフェニル 基、3、5-ジフルオロフェニル基、2、4-ジフルオロフェニル基、2、6-

ジフルオロフェニル基、2、3-ジクロロフェニル基、3、4-ジクロロフェニ ル基、3,5-ジクロロフェニル基、2,4-ジクロロフェニル基、2,6-ジ クロロフェニル基、2、3、4ートリフルオロフェニル基、3、4、5ートリフ ルオロフェニル基、3,4,5-トリクロロフェニル基、2,4,6-トリフル オロフェニル基、2、3、4、5、6ーペンタフルオロフェニル基、2、4、6 ートリクロロフェニル基、2ーフルオロー4ークロロフェニル基、2ーフルオロ - 4 - ブロモフェニル基、3 - フルオロ-4 - クロロフェニル基、2 - メチルフ エニル基、3ーメチルフェニル基、4ーメチルフェニル基、2,6ージメチルフ エニル基、2,4,6-トリメチルフェニル基、2-メチル-3-クロロフェニ ル基、3-メチルー4-クロロフェニル基、2-クロロー4-メチルフェニル基、 10 2-メチル-3-フルオロフェニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、3 ートリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、3,5 ージ (トリフルオロメチル) フェニル基、3,4-ジ(トリフルオロメチル)フ エニル基、2,4-ジ(トリフルオロメチル)フェニル基、2-ペンタフルオロ 15 エチルフェニル基、3-ペンタフルオロエチルフェニル基、4-ペンタフルオロ エチルフェニル基、2ーイソプロピルフェニル基、3ーイソプロピルフェニル基、 4ーイソプロピルフェニル基、2-tertーブチルフェニル基、3-tert ーブチルフェニル基、4-tertーブチルフェニル基、2-secーブチルフ ェニル基、3-sec-ブチルフェニル基、4-sec-ブチルフェニル基、4 -n-ブチルフェニル基、4-n-ペンチルフェニル基、4-n-ヘキシルフェ 20 ニル基、2-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、3-n-ヘプタフルオロ プロピルフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-ペンチ ルフェニル基、4-ヘキシルフェニル基、2-メトキシフェニル基、3-メトキ シフェニル基、4-メトキシフェニル基、2-メトキシー3-クロロフェニル基、 2-フルオロ-3-メトキシフェニル基、2-フルオロ-4-メトキシフェニル 25 基、4-シクロプロピルフェニル基、4-シクロブチルフェニル基、4-シクロ ペンチルフェニル基、4ーシクロヘキシルフェニル基、4ーシクロヘプチルフェ ニル基、4-シクロオクチルフェニル基、2,6-ジメトキシフェニル基、2-トリフルオロメトキシフェニル基、3-トリフルオロメトキシフェニル基、4-

トリフルオロメトキシフェニル基、2,3-ジ(トリフルオロメトキシ)フェニ ル基、3,5-ジ(トリフルオロメトキシ)フェニル基、2,4-ジ(トリフル オロメトキシ)フェニル基、2-ペンタフルオロエトキシフェニル基、3-ペン タフルオロエトキシフェニル基、4-ペンタフルオロエトキシフェニル基、2-5 イソプロポキシフェニル基、3-イソプロポキシフェニル基、4-イソプロポキ シフェニル基、2-tert-ブトキシフェニル基、3-tert-ブトキシフ エニル基、4-tertーブトキシフェニル基、2-secーブトキシフェニル 基、3-sec-ブトキシフェニル基、4-sec-ブトキシフェニル基、4n-ヘキシルオキシフェニル基、4-n-ヘプチルオキシフェニル基、4-n-オクチルオキシフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、3 10 - n - ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロポキ シフェニル基、4-シクロプロポキシフェニル基、4-シクロブトキシフェニル 基、4-シクロペントキシフェニル基、4-シクロヘキシルオキシフェニル基、 4-シクロヘプチルオキシフェニル基、4-シクロオクチルオキシフェニル基、 4-ペントキシフェニル基、4-ヘキシルオキシフェニル基、2-ヒドロキシフ 15 ェニル基、3-ヒドロキシフェニル基、4-ヒドロキシフェニル基、2,4-ジ ヒドロキシフェニル基、2,4,6-トリヒドロキシフェニル基、2-メトキシ - 3 - クロロフェニル基、2 - フルオロ-3 - ヒドロキシフェニル基、2 - フル オロー4ーヒドロキシフェニル基、2,3ーメチレンジオキシフェニル基、3, 4-メチレンジオキシフェニル基、2、3-エチレンジオキシフェニル基、3、 20 4-エチレンジオキシフェニル基、2-シアノフェニル基、3-シアノフェニル 基、4-シアノフェニル基、2、3-ジシアノフェニル基、2、4、6-トリシ アノフェニル基、2-ニトロフェニル基、3-ニトロフェニル基、4-ニトロフ エニル基、2,4-ジニトロフェニル基、2,4,6-トリニトロフェニル基、 2-シンナミルフェニル基、3-シンナミルフェニル基、4-シンナミルフェニ 25ル基、2-アセチルオキシフェニル基、3-アセチルオキシフェニル基、2-ア ミノフェニル基、2, 4-ジアミノフェニル基、2, 4, 6-トリアミノフェニ ル基、4-アセチルオキシフェニル基、2-プロピオニルオキシフェニル基、3 - プロピオニルオキシフェニル基、4 - プロピオニルオキシフェニル基、2 - ブ

チリルオキシフェニル基、3-ブチリルオキシフェニル基、4-ブチリルオキシ フェニル基、4ーペンタノイルオキシフェニル基、4ーヘキサノイルオキシフェ ニル基、2ーアセチルアミノフェニル基、3ーアセチルアミノフェニル基、4ー アセチルアミノフェニル基、2ープロピオニルアミノフェニル基、3ープロピオ ニルアミノフェニル基、4-プロピオニルアミノフェニル基、2-ブチリルアミ ノフェニル基、3ーブチリルアミノフェニル基、4ーブチリルアミノフェニル基、 4ーペンタノイルアミノフェニル基、4ーヘキサノイルアミノフェニル基、2ー メタンスルホニルアミノフェニル基、3-メタンスルホニルアミノフェニル基、 4-メタンスルホニルアミノフェニル基、2-ベンジルオキシフェニル基、3-ベンジルオキシフェニル基、4ーベンジルオキシフェニル基、2-(2-フェニ 10 ルエトキシ)フェニル基、3-(2-フェニルエトキシ)フェニル基、4-(2 ーフェニルエトキシ)フェニル基、2-(3-フェニルプロポキシ)フェニル基、 3- (3-フェニルプロポキシ)フェニル基、4- (3-フェニルプロポキシ) フェニル基、2-(4-フェニルブトキシ)フェニル基、3-(4-フェニルブ トキシ)フェニル基、4-(4-フェニルブトキシ)フェニル基、2-(5-フ 15 ェニルペントキシ)フェニル基、3-(5-フェニルペントキシ)フェニル基、 4-(5-フェニルペントキシ)フェニル基、2-(6-フェニルヘキシルオキ シ)フェニル基、3-(6-フェニルヘキシルオキシ)フェニル基、4-(6-フェニルヘキシルオキシ)フェニル基、2-フェノキシフェニル基、3-フェノ キシフェニル基、4-フェノキシフェニル基、2-メチルアミノフェニル基、3 20 ーエチルアミノフェニル基、4-プロピルアミノフェニル基、2-n-ブチルア ミノフェニル基、3-n-ペンチルアミノフェニル基、4-n-ヘキシシルアミ ノフェニル基、2-ジメチルアミノフェニル基、3-ジメチルアミノフェニル基、 4-ジメチルアミノフェニル基、2-ジエチルアミノフェニル基、3-ジエチル アミノフェニル基、4-ジエチルアミノフェニル基、2-ジ- (n-プロピル) 25 アミノフェニル基、3-ジー (n-プロピル) アミノフェニル基、4-ジー (n ープロピル) アミノフェニル基、3ーフェニルアミノフェニル基、2ージフェニ ルアミノフェニル基、3-ジフェニルアミノフェニル基、4-ジフェニルアミノ フェニル基、2-(2-メチルアミノエトキシ)フェニル基、3-エチルアミノ

メトキシフェニル基、2-(2-ジメチルアミノエトキシ)フェニル基、3-(2-ジメチルアミノエトキシ)フェニル基、4-(2-ジメチルアミノエトキ シ)フェニル基、2-(3-ジメチルアミノプロポキシ)フェニル基、3-(3 ージメチルアミノプロポキシ)フェニル基、4-(3-ジメチルアミノプロポキ - シ)フェニル基、4-(4-ジメチルアミノブトキシ)フェニル基、4-(5-ジメチルアミノペントキシ)フェニル基、4-(6 ―ジメチルアミノヘキシルオ キシ)フェニル基、2-(2-ジエチルアミノエトキシ)フェニル基、3-(2 ージエチルアミノエトキシ)フェニル基、4-(2-ジエチルアミノエトキシ) フェニル基、2-(3-ジェチルアミノプロポキシ)フェニル基、3-(3-ジ エチルアミノプロポキシ)フェニル基、4-(3-ジエチルアミノプロポキシ) 10 フェニル基、4-(4-ジエチルアミノブトキシ)フェニル基、4-(5-ジェ チルアミノペントキシ)フェニル基、4-(6-ジエチルアミノヘキシルオキ シ)フェニル基、2ーメトキシカルボニルフェニル基、3ーメトキシカルボニル フェニル基、4-メトキシカルボニルフェニル基、2-エトキシカルボニルフェ 15 ニル基、3-エトキシカルボニルフェニル基、4-エトキシカルボニルフェニル 基、4-(3-プロポキシカルボニル)フェニル基、4-(4-ブトキシカルボ ニル)フェニル基、4-(5-ペントキシカルボニル)フェニル基、4-(6-ヘキシルオキシカルボニル)フェニル基、2-メトキシカルボニルメトキシフェ ニル基、3-メトキシカルボニルメトキシフェニル基、4-メトキシカルボニル メトキシフェニル基、2-エトキシカルボニルメトキシフェニル基、3-エトキ シカルボニルメトキシフェニル基、4-エトキシカルボニルメトキシフェニル基、 4- (3-プロポキシカルボニル) メトキシフェニル基、4- (4-ブトキシカ ルボニル)メトキシフェニル基、4-(5-ペントキシカルボニル)メトキシフ ェニル基、4-(6-ヘキシルオキシカルボニル)メトキシフェニル基、4-(2-メトキシカルボニルエトキシ)フェニル基、4-(2-エトキシカルボニ 25 ル) エトキシフェニル基、4-(2-(3-プロポキシカルボニル) エトキシ) フェニル基、4-(2-(4-ブトキシカルボニル)エトキシ)フェニル基、4 - (2-(5-ペントキシカルボニル)エトキシ)フェニル基、4-(2-(6 ーヘキシルオキシカルボニル)エトキシ)フェニル基、4-(3-メトキシカル

ボニルプロポキシ)フェニル基、4-(3-(2-エトキシカルボニル)プロポ キシ)フェニル基、4-(3-(3-プロポキシカルボニル)プロポキシ)フェ ニル基、4-(3-(4-ブトキシカルボニル)プロポキシ)フェニル基、4-(3-(5-ペントキシカルボニル)プロポキシ)フェニル基、4-(3-(6 5 - ヘキシルオキシカルボニル)プロポキシ)フェニル基、4-(4-メトキシカ ルボニルブトキシ)フェニル基、4-(4-(2-エトキシカルボニル)ブトキ シ)フェニル基、4-(5-メトキシカルボニルペントキシ)フェニル基、4-(5-(2-エトキシカルボニル)ペントキシ)フェニル基、4-(6-(2-エトキシカルボニル)へキシルオキシ)フェニル基、2-メチルチオフェニル基、 3-メチルチオフェニル基、4-メチルチオフェニル基、4-エチルチオフェニ 10 ル基、4-n-プロピルチオフェニル基、4-イソプロピルチオフェニル基、4 -n-ブチルチオフェニル基、4-tert-ブチルチオフェニル基、4-n-ペンチルチオフェニル基、4-n-ヘキシルチオフェニル基、2-(1-ピロリ ル)フェニル基、3-(1-ピロリル)フェニル基、4-(1-ピロリル)フェ ニル基、2- (1-イミダゾリル)フェニル基、3- (1-イミダゾリル)フェ 15 ニル基、4-(1-イミダゾリル)フェニル基、2-ピペリジノフェニル基、3 - ピペリジノフェニル基、4ーピペリジノフェニル基、4ーモルホリノフェニル 基、3-モルホリノフェニル基、2-モルホリノフェニル基、2-(1-ピロリ ジニル)フェニル基、3-(1-ピロリジニル)フェニル基、4-(1-ピロリ ジニル)フェニル基、2-(2-チエニル)フェニル基、3-(2-チエニル) 20 フェニル基、4-(2-チエニル)フェニル基、2-(2-ベンゾフリル)フェ ニル基、3-(2-ベンゾフリル)フェニル基、4-(2-ベンゾフリル)フェ ' ニル基、2-(1-ピペラジニル)フェニル基、3-(1-ピペラジニル)フェ ニル基、4-(1-ピペラジニル)フェニル基、2-(4ーメチルー1ーピペラ ジニル)フェニル基、3-(4-メチル-1-ピペラジニル)フェニル基、4-25(4-メチル-1-ピペラジニル)フェニル基、4-(4-エチル-1-ピペラ ジニル)フェニル基、4-(4-n-プロピル-1-ピペラジニル)フェニル基、 4- (4-イソプロピル-1-ピペラジニル)フェニル基、4- (4-n-ブチ ルー1-ピペラジニル)フェニル基、4-(4-tertーブチルー1-ピペラ

ジニル)フェニル基、4-(4-n-ペンチル-1-ピペラジニル)フェニル基、 4- (4-n-ヘキシル-1-ピペラジニル) フェニル基、4- (4-ベンジル -1-ピペラジニル)フェニル基、4-(4-(2-フェネチル)-1-ピペラ ジニル)フェニル基、4-(4-(3-フェニルプロピル)-1-ピペラジニ 5 ル)フェニル基、4-(4-(4-フェニルブチル)-1-ピペラジニル)フェ ニル基、4-(4-(5-フェニルペンチル)-1-ピペラジニル)フェニル基、 4-(4-(6-フェニルヘキシル)-1-ピペラジニル)フェニル基、4-(4-ベンゾイル-1-ピペラジニル)フェニル基、4-(4-(2-メチルベ ンゾイル)-1-ピペラジニル)フェニル基、4-(4-(2,3-ジメチルベ - ンゾイル)-1-ピペラジニル)フェニル基、4-(4-(2,4,6-トリメ 10 チルベンゾイル) -1-ピペラジニル) フェニル基、4-(4-(3-メチルベ ンゾイル)-1-ピペラジニル)フェニル基、4-(4-(4-メチルベンゾイ ル) -1-ピペラジニル) フェニル基、4-(4-(4-エチルベンゾイル) -1-ピペラジニル)フェニル基、4-(4-(4-イソプロピルベンゾイル)-1-ピペラジニル)フェニル基、4-(4-(4-n-ブチルベンゾイル)-1 15 -ピペラジニル)フェニル基、4-(4-(4-n-2)ンチルベンゾイル)-1ーピペラジニル)フェニル基、4- (4- n-ヘキシルベンゾイル) -1 ーピペラジニル)フェニル基、3-(2-キノリル)フェニル、4-(4,5, 6-トリメトキシー3ーキノリル)フェニル基、4-(6-メトキシー2-キノ リル)フェニル基、2-(5,6-ジメトキシ-4-キノリル)フェニル基、3 20 -(2-オキソー3-キノリル)フェニル基、4-(2-オキソー3-キノリ ル)フェニル基、3-(5-メトキシ-2-オキソ-3-キノリル)フェニル基、 4- (5-メトキシー2-オキソー3-キノリル)フェニル基、3- (6-メト キシー2ーオキソー7ーキノリル)フェニル基、4-(6ーメトキシー2ーオキ - ソー3ーキノリル)フェニル基、3-(7-メトキシー2-オキソー6-キノリ 25 ル)フェニル基、4ー(7-メトキシー2-オキソー8-キノリル)フェニル基、 3-(8-メトキシー2-オキソー3-キノリル)フェニル基、4-(8-メト キシ-2-オキソ-3-キノリル)フェニル基、3-(5,6-ジエトキシ-2 ーオキソー4ーキノリル)フェニル基、4-(5-エトキシ-2-オキソー3-

キノリル)フェニル基、3-(6-エトキシ-2-オキソ-5-キノリル)フェ ニル基、4-(6-エトキシ-2-オキソ-3-キノリル)フェニル基、3-(7-エトキシ-2-オキソ-3-キノリル) フェニル基、4-(7-エトキシ -2-オキソ-3-キノリル)フェニル基、3-(8-エトキシ-2-オキソー 3-キノリル)フェニル基、4-(8-エトキシ-2-オキソ-3-キノリル) 5 フェニル基、3-(1-ピペリジニルカルボニル)フェニル、4-(4-(カル ボスチリル-1-イル)ピペリジニル-1-カルボニル)フェニル基、4-(1, 2, 4-トリアゾールー1ーイル)フェニル基等のフェニル基(フェニル環上に は、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6のアルキル基;C3 ~8シクロアルキル基;ヒドロキシル基;ハロゲン置換もしくは未置換のC1~ 10 8のアルコキシ基; C3~8シクロアルコキシ基; C1~4アルキレンジオキシ 基;シアノ基;ニトロ基;フェニルC2~6アルケニル基;C2~6アルカノイ ルオキシ基;置換基としてC1~6アルカノイル基を1~2個有することのある アミノ基;C1~6アルキルスルホニルアミノ基;フェニルC1~6アルコキシ 基;フェノキシ基;置換基としてC1~6アルキル基が1~2個置換したアミノ 15 基;フェニル基が1~2個置換したアミノ基;置換基としてC1~6アルキル基 が $1 \sim 2$ 個置換していてもよいアミノC $1 \sim 6$ アルコキシ基; C $1 \sim 6$ アルコキ シカルボニル基; $C1\sim6$ アルコキシカルボニル $C1\sim6$ アルコキシ基; $C1\sim$ 6アルキルチオ基;ピロリル基;イミダゾリル基;ピペリジル基;モルホリノ 基;ピロリジニル基;チエニル基;ベンゾフリル基;ピペラジニル基[ピペラジ 20 ン環上には、置換基としてC1~6アルキル基、フェニルC1~6アルキル基及 びC1~6アルキル基を1~3個有することのあるベンゾイル基からなる群より 選ばれた基が少なくとも1種置換していてもよい];キノリン環上にC1~6ア ルコキシ基及びオキソ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換して いてもよいキノリル基;ピペリジン環上にカルボスチリル基が置換していてもよ 25 いピペリジルカルボニル基及びトリアゾリル基からなる群より選ばれた基が1~ 5個、好ましくは1~3個置換していてもよい。置換基が<math>C1~4アルキレンジ オキシ基の場合は、1~3個置換するのがよい。)を挙げることができる。

ナフチル基 (ナフタレン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置

換のC1~6アルコキシ基及び置換基としてC1~6アルキル基を有することの あるアミノ基なる群から選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)と しては、例えば、1-ナフチルメチル基、2-(2-ナフチル)エチル基、1-(3ーナフチル) エチル基、3-(4ーナフチル) プロピル基、4-(5ーナフ チル)ブチル基、5-(6-ナフチル)ペンチル基、6-(7-ナフチル)へキ シル基、2-メチル-3-(8-ナフチル)プロピル基、1,1-ジメチル-2 - (3-ナフチル) エチル基、2-フルオロ-1-ナフチル基、2-クロロ-1 ーナフチル基、2ーブロモー1ーナフチル基、3ーフルオロー1ーナフチル基、 3-クロロ-1-ナフチル基、3-ブロモ-1-ナフチル基、4-フルオロ-1 ーナフチル基、4-クロロー1-ナフチル基、4-ブロモー1-ナフチル基、5 10 ーフルオロー1ーナフチル基、5ークロロー1ーナフチル基、5ーブロモー1ー ナフチル基、6-フルオロ-1-ナフチル基、6-クロロ-1-ナフチル基、6 ーブロモー1ーナフチル基、7ーフルオロー1ーナフチル基、7ークロロー1ー ナフチル基、7-ブロモ-1-ナフチル基、1-フルオロ-2-ナフチル基、8 ーフルオロー1ーナフチル基、8ークロロー1ーナフチル基、8ーブロモー1ー 15 ナフチル基、1-フルオロー2-ナフチル基、1-クロロー2-ナフチル基、1 -ブロモ-2-ナフチル基、3-フルオロ-2-ナフチル基、3-クロロ-2-ナフチル基、3-ブロモー2-ナフチル基、4-フルオロー2-ナフチル基、4 --クロロ--2-ナフチル基、4-ブロモ-2-ナフチル基、4-ジメチルアミノ -1-ナフチル基、2-メトキシ-1-ナフチル基、3-メトキシ-1-ナフチ 20 ル基、4ーメトキシー1ーナフチル基、5ーメトキシー1ーナフチル基、6ーメ トキシ-1-ナフチル基、7-メトキシ-1-ナフチル基、8-メトキシ-1-ナフチル基、2-トリフルオロメトキシ-1-ナフチル基、3-トリフルオロメ トキシー1ーナフチル基、4ートリフルオロメトキシー1ーナフチル基、5ート リフルオロメトキシー1ーナフチル基、6ートリフルオロメトキシー1ーナフチ 25 ル基、7ートリフルオロメトキシー1ーナフチル基、8ートリフルオロメトキシ -1-ナフチル基、3-アミノー2-ナフチル基、2-メチルアミノー1-ナフ チル基、4-エチルアミノー2-ナフチル基、5-プロピルアミノー1-ナフチ ル基、6-n-ブチルアミノ-2-ナフチル基、7-n-ペンチルアミノ-1-

ナフチル基、8-ヘキシルアミノー2-ナフチル基、2,3-ジクロロー1-ナ フチル基、2,4,6-トリクロロー1-ナフチル基、2-クロロー4-トリフ ルオロメトキシー1ーナフチル基、2-クロロー6ージメチルアミノー1ーナフ チル基、2-ジメチルアミノー1-ナフチル基、3-ジメチルアミノー1-ナフ 5 チル基、4-ジメチルアミノー1-ナフチル基、5-ジメチルアミノー1ーナフ チル基、6-ジメチルアミノー1-ナフチル基、7-ジメチルアミノー1-ナフ チル基、8-ジメチルアミノ-1-ナフチル基、1-メトキシ-2-ナフチル基、 3-メトキシ-2-ナフチル基、4-メトキシ-2-ナフチル基、5-メトキシ -2-ナフチル基、6-メトキシ-2-ナフチル基、7-メトキシ-2-ナフチ ル基、8-メトキシー2-ナフチル基、1-トリフルオロメトキシー2ーナフチ ル基、3ートリフルオロメトキシー2-ナフチル基、4-トリフルオロメトキシ - 2-ナフチル基、5-トリフルオロメトキシ-2-ナフチル基、6-トリフル オロメトキシー2ーナフチル基、7ートリフルオロメトキシー2ーナフチル基、 8-トリフルオロメトキシー2-ナフチル基、1-ジメチルアミノー2ーナフチ 15 ル基、3-ジメチルアミノー2ーナフチル基、4-ジメチルアミノー2ーナフチ ル基、5-ジメチルアミノ-2-ナフチル基、6-ジメチルアミノ-2-ナフチ ル基、7-ジメチルアミノー2ーナフチル基、8-ジメチルアミノー2ーナフチ ル基等のナフタレン環上にハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~ 6アルコキシ基及び置換基としてC1~6アルキル基を1~2個有することのあ 20 るアミノ基なる群から選ばれた基が1~3個置換していてもよいナフチル基を挙 げることができる。

ビフェニリル基(ビフェニリル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~9アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、3ービフェニリル基、4ービフェニリル基、2'ーフルオロー3ービフェニリル基、3'ーフルオロー3ービフェニリル基、4'ーフルオロー3ービフェニリル基、3'、4'ージフルオロー3ービフェニリル基、3'、4'、5'ートリクロロー3ービフェニリル基、2'、3'、4'、5'、6'ーペンタフルオロー4ービフェニリル基、2'ーフルオロー3'、4'ージトリ

フルオロメチルー3ービフェニリル基、2',4'ージフルオロー3ービフェニ リル基、3′、5′ージフルオロー3ービフェニリル基、2′ークロロー3ービ フェニリル基、3′ークロロー3ービフェニリル基、4′ークロロー3ービフェ ニリル基、3′,4′ージクロロー3ービフェニリル基、2′,4′ージクロロ 5 -3-ビフェニリル基、3′,5′-ジクロロ-3-ビフェニリル基、2′-メ チルー3ービフェニリル基、3'ーメチルー3ービフェニリル基、4'ーメチル -3-ビフェニリル基、3',4'-ジメチル-3-ビフェニリル基、2', 4'ージメチルー3ービフェニリル基、3',5'ージメチルー3ービフェニリ ル基、2'ートリフルオロメチルー3ービフェニリル基、3'ートリフルオロメ 10 チルー3ービフェニリル基、4'ートリフルオロメチルー3ービフェニリル基、 3′、4′ージトリフルオロメチルー3ービフェニリル基、2′、4′ージトリ フルオロメチルー3ービフェニリル基、3'、5'ージトリフルオロメチルー3 ービフェニリル基、2'ーメトキシー3ービフェニリル基、3'ーメトキシー3 ービフェニリル基、4'ーメトキシー3ービフェニリル基、3',4'ージメト 15 キシー3ービフェニリル基、2'、4'ージメトキシー3ービフェニリル基、 3′、4′、5′ートリメトキシー3ービフェニリル基、3′、5′ージメトキ シー3-ビフェニリル基、2'-トリフルオロメトキシー3-ビフェニリル基、 3'ートリフルオロメトキシー3ービフェニリル基、4'ートリフルオロメトキ シー3ービフェニリル基、3',4'ージトリフルオロメトキシー3ービフェニ リル基、2′、4′ージトリフルオロメトキシー3ービフェニリル基、3′、 20 5'ージトリフルオロメトキシー3ービフェニリル基、2'ーフルオロー4ービ フェニリル基、3, -フルオロ-4-ビフェニリル基、4, -フルオロ-4-ビ フェニリル基、3′, 4′ージフルオロー4ービフェニリル基、2′, 4′ージ フルオロー4ービフェニリル基、3′,5′ージフルオロー4ービフェニリル基、 2'-クロロー4ービフェニリル基、3'-クロロー4ービフェニリル基、4' 25ークロロー4ービフェニリル基、3′, 4′ージクロロー4ービフェニリル基、 2'、4'ージクロロー4ービフェニリル基、3'、5'ージクロロー4ービフ ェニリル基、2'ーメチルー4ービフェニリル基、3'ーメチルー4ービフェニ リル基、4'ーメチルー4ービフェニリル基、4'ーエチルー4ービフェニリル

基、4['] - n - プロピルー4 - ビフェニリル基、4['] - n - ブチルー4 - ビフェニリル基、4['] - n - ペンチルー4 - ビフェニリル基、4['] - n - ペキシルー4 - ビフェニリル基、4['] - n - ペプチルー4 - ビフェニリル基、4['] - n - オクチルー4 - ビフェニリル基、3['],

- 5 4' -ジメチルー4ービフェニリル基、2', 4' -ジメチルー4ービフェニリル基、3', 5' -ジメチルー4ービフェニリル基、3', 4', 5' ートリメチルー4ービフェニリル基、2'ートリフルオロメチルー4ービフェニリル基、3'ートリフルオロメチルー4ービフェニリル基、4'ートリフルオロメチルー4ービフェニリル基、4'ージトリフルオロメチルー4ービフェニリル基、
- 2', 4'ージトリフルオロメチルー4ービフェニリル基、3', 5'ージトリフルオロメチルー4ービフェニリル基、2'ーメトキシー4ービフェニリル基、3'ーメトキシー4ービフェニリル基、4'ーメトキシー4ービフェニリル基、3', 4'ージメトキシー4ービフェニリル基、2', 4'ージメトキシー4ービフェニリル基、ビフェニリル基、3', 4'ージメトキシー2'ークロロー4ービフェニリル基、
- 15 3', 5', -ジメトキシー4ービフェニリル基、2', -トリフルオロメトキシー4ービフェニリル基、3', -トリフルオロメトキシー4ービフェニリル基、4', -ドリフルオロメトキシー4ービフェニリル基、3', 4', -ジトリフルオロメトキシー4ービフェニリル基、2', 4', -ジトリフルオロメトキシー4ービフェニリル基、3', 5', -ジトリフルオロメトキシー4ービフェニリル基等のビ
- 20 フェニリル基(ビフェニリル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim9$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基が $1\sim5$ 個、好ましくは $1\sim3$ 個置換していてもよい)を挙げることができる。

ベンゾチエニル基(ベンゾチオフェン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換 もしくは未置換のC1~6アルキル及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。)としては、例えば、2ーベンゾチエニル基、3ーベンゾチエニル基、3ーメチルー2ーベンゾチエニル基、4ーフルオロー2ーベンゾチエニル基、4,5,

6-トリクロロ-2-ベンゾチエニル基、6-フルオロ-2-ベンゾチエニル基、 7-フルオロ-2-ベンゾチエニル基、4-クロロ-2-ベンゾチエニル基、5 ークロロー2ーベンゾチエニル基、6ークロロー2ーベンゾチエニル基、7ーク ロロー2ーベンゾチエニル基、4ーブロモー2ーベンゾチエニル基、5ーブロモ - 2 - ベンゾチエニル基、 6 - ブロモー 2 - ベンゾチエニル基、 7 - ブロモー 2 ーベンゾチエニル基、5-メチル-2-ベンゾチエニル基、6-メチル-2-ベ ンゾチエニル基、7ーメチルー2ーベンゾチエニル基、4ートリフルオロメチル - 2 - ベンゾチエニル基、5 - トリフルオロメチル-2 - ベンゾチエニル基、6 ートリフルオロメチルー 2 ーベンゾチエニル基、 7 ートリフルオロメチルー 2 ー ベンゾチエニル基、4ーエチルー2ーベンゾチエニル基、5ーエチルー2ーベン 10 ゾチエニル基、6-エチル-2-ベンゾチエニル基、7-エチル-2-ベンゾチ エニル基、4-ペンタフルオロエチル-2-ベンゾチエニル基、5-ペンタフル オロエチルー2-ベンゾチエニル基、6-ペンタフルオロエチルー2-ベンゾチ エニル基、7-ペンタフルオロエチル-2-ベンゾチエニル基、4-メトキシ-2-ベンゾチエニル基、5-メトキシ-2-ベンゾチエニル基、6-メトキシ-15 2-ベンゾチエニル基、7-メトキシ-2-ベンゾチエニル基、4-トリフルオ ロメトキシー2ーベンゾチエニル基、5-トリフルオロメトキシー2-ベンゾチ エニル基、6-トリフルオロメトキシ-2-ベンゾチエニル基、7-トリフルオ ロメトキシー2-ベンゾチエニル基、4-フルオロー3-メチルー2-ベンゾチ エニル基、5-フルオロー3-メチルー2-ベンゾチエニル基、6-フルオロー 20 3-メチル-2-ベンゾチエニル基、7-フルオロ-3-メチル-2-ベンゾチ エニル基、4ークロロー3ーメチルー2ーベンゾチエニル基、5ークロロー3ー メチルー2-ベンゾチエニル基、6-クロロー3-メチルー2-ベンゾチエニル 基、7-クロロー3-メチルー2-ベンゾチエニル基、4-ブロモー3-メチル -2-ベンゾチエニル基、5-ブロモ-3-メチル-2-ベンゾチエニル基、6 25 ーブロモー3ーメチルー2ーベンゾチエニル基、7ーブロモー3ーメチルー2ー ベンゾチエニル基、5-メチル-3-メチル-2-ベンゾチエニル基、6-メチ ルー3-メチルー2-ベンゾチエニル基、7-メチルー3-メチルー2-ベンゾ チエニル基、3,4,6ートリメチル-2ーベンゾチエニル基、4,5,6-ト

リメトキシー2-ベンゾチエニル基、4-トリフルオロメチルー3-メチルー2 -ベンゾチエニル基、5-トリフルオロメチル-3-メチル-2-ベンゾチエニ ル基、6-トリフルオロメチル-3-メチル-2-ベンゾチエニル基、7-トリ フルオロメチルー3-メチルー2-ベンゾチエニル基、4-エチルー3-メチル - 2 - ベンゾチエニル基、5 - エチル-3 - メチル-2 - ベンゾチエニル基、6 -エチル-3-メチル-2-ベンゾチエニル基、7-エチル-3-メチル-2-ベンゾチエニル基、4ーペンタフルオロエチル-3-メチル-2-ベンゾチエニ ル基、5-ペンタフルオロエチル-3-メチル-2-ベンゾチエニル基、6-ペ ンタフルオロエチルー3-メチルー2-ベンゾチエニル基、7-ペンタフルオロ エチル-3-メチル-2-ベンゾチエニル基、4-メトキシ-3-メチル-2-10 ベンゾチエニル基、5-メトキシ-3-メチル-2-ベンゾチエニル基、6-メ トキシー3-メチルー2-ベンゾチエニル基、7-メトキシー3-メチルー2-ベンゾチエニル基、4-トリフルオロメトキシ-3-メチル-2-ベンゾチエニ ル基、5ートリフルオロメトキシー3-メチルー2-ベンゾチエニル基、6-ト リフルオロメトキシー3ーメチルー2ーベンゾチエニル基、7ートリフルオロメ 15 トキシー3-メチルー2-ベンゾチエニル基、4-イソプロピルー2-ベンゾチ エニル基、5-イソプロピルー3-メチル-2-ベンゾチエニル基、6-イソプ ロピルー2-ベンゾチエニル基、7-イソプロピルー2-ベンゾチエニル基、4 - ヘキシル-2-ベンゾチエニル基、5-ヘキシル-2-ベンゾチエニル基、6 - ヘキシル-2-ベンゾチエニル基、7-ヘキシル-2-ベンゾチエニル基、4 20 -エトキシ-2-ベンゾチエニル基、5-エトキシ-2-ベンゾチエニル基、6 -エトキシ-2-ベンゾチエニル基、7-エトキシ-2-ベンゾチエニル基、4 ーフルオロー5ートリフルオロメチルー2-ベンゾチエニル基、6-フルオロー 5-トリフルオロメチルー2-ベンゾチエニル基、7-フルオロー5-トリフル オロメチル-2-ベンゾチエニル基、4-クロロ-5-トリフルオロメチル-2 ーベンゾチエニル基、6-クロロ-5-トリフルオロメチル-2-ベンゾチエニ ル基、7-クロロ-5-トリフルオロメチル-2-ベンゾチエニル基、4-クロ ロ-5-トリフルオロメトキシ-2-ベンゾチエニル基、6-クロロ-5-トリ フルオロメトキシー2-ベンゾチエニル基、7-クロロー5-トリフルオロメト

キシー2ーベンゾチエニル基、4ーフルオロー3ーベンゾチエニル基、5ーフル オロー3ーベンゾチエニル基、6ーフルオロー3ーベンゾチエニル基、7ーフル オロー3ーベンゾチエニル基、4ークロロー3ーベンゾチエニル基、5ークロロ - 3 - ベンゾチエニル基、6 - クロロー3 - ベンゾチエニル基、7 - クロロー3 - 一ベンゾチエニル基、4ーブロモー3ーベンゾチエニル基、5ーブロモー3ーベ ンゾチエニル基、6-ブロモー3-ベンゾチエニル基、7-ブロモー3-ベンゾ チエニル基、4-フルオロー3-ベンゾチエニル基、5-メチルー3-ベンゾチ エニル基、6-メチル-3-ベンゾチエニル基、7-メチル-3-ベンゾチエニ ル基、4ートリフルオロメチルー3ーベンゾチエニル基、5ートリフルオロメチ ルー3-ベンゾチエニル基、6-トリフルオロメチル-3-ベンゾチエニル基、 10 7ートリフルオロメチルー3ーベンゾチエニル基、4ーフルオロー2ーメチルー 3-ベンゾチエニル基、5-フルオロ-2-メチル-3-ベンゾチエニル基、6 ーフルオロー2-メチルー3-ベンゾチエニル基、7-フルオロー2-メチルー 3ーベンゾチエニル基、4ークロロー2ーメチルー3ーベンゾチエニル基、5ー クロロー2ーメチルー3ーベンゾチエニル基、6ークロロー2ーメチルー3ーベ 15 ンゾチエニル基、7-クロロー2-メチルー3-ベンゾチエニル基、4-ブロモ - 2-メチル-3-ベンゾチエニル基、5-ブロモ-2-メチル-3-ベンゾチ エニル基、6-ブロモー2-メチルー3-ベンゾチエニル基、7-ブロモー2-メチルー3-ベンゾチエニル基、4-フルオロー2-メチルー3-ベンゾチエニ ル基、5-メチル-2-メチル-3-ベンゾチエニル基、6-メチル-2-メチ 20 ルー3-ベンゾチエニル基、7-メチルー2-メチルー3-ベンゾチエニル基、 4ートリフルオロメチルー2ーメチルー3ーベンゾチエニル基、5ートリフルオ ロメチルー2ーメチルー3ーベンゾチエニル基、6ートリフルオロメチルー2ー メチルー3ーベンゾチエニル基、7ートリフルオロメチルー2ーメチルー3ーベ ンゾチエニル基、4-エチル-3-ベンゾチエニル基、5-エチル-3-ベンゾ 25 チエニル基、6-エチル-3-ベンゾチエニル基、7-エチル-3-ベンゾチエ ニル基、4-ペンタフルオロエチルー3-ベンゾチエニル基、5-ペンタフルオ ロエチルー3ーベンゾチエニル基、6ーペンタフルオロエチルー3ーベンゾチエ ニル基、7ーペンタフルオロエチルー3ーベンゾチエニル基、4ーメトキシー3

ーベンゾチエニル基、5-メトキシー3-ベンゾチエニル基、6-メトキシー3 ーベンゾチエニル基、7-メトキシー3ーベンゾチエニル基、4ートリフルオロ メトキシー3-ベンゾチエニル基、5-トリフルオロメトキシー3-ベンゾチエ ニル基、6-トリフルオロメトキシー3-ベンゾチエニル基、7-トリフルオロ メトキシー3-ベンゾチエニル基、4-イソプロピルー3-ベンゾチエニル基、 5-イソプロピル-3-ベンゾチエニル基、6-イソプロピル-3-ベンゾチエ ニル基、7-イソプロピル-3-ベンゾチエニル基、4-ヘキシル-3-ベンゾ チエニル基、5-ヘキシル-3-ベンゾチエニル基、6-ヘキシル-3-ベンゾ チエニル基、7-ヘキシル-3-ベンゾチエニル基、4-エトキシ-3-ベンゾ チエニル基、5-エトキシ-3-ベンゾチエニル基、6-エトキシ-3-ベンゾ 10 チエニル基、7-エトキシー3-ベンゾチエニル基、4-フルオロー5ートリフ ルオロメチルー3ーベンゾチエニル基、6ーフルオロー5ートリフルオロメチル -3-ベンゾチエニル基、7-フルオロ-5-トリフルオロメチル-3-ベンゾ チエニル基、4-クロロ-5-トリフルオロメチル-3-ベンゾチエニル基、6 15 ークロロー5ートリフルオロメチルー3ーベンゾチエニル基、7ークロロー5ー トリフルオロメチル-3-ベンゾチエニル基、4-クロロ-5-トリフルオロメ トキシー3ーベンゾチエニル基、6ークロロー5ートリフルオロメトキシー3ー ベンゾチエニル基、7-クロロー5-トリフルオロメトキシー3-ベンゾチエニ ル基等のベンゾチエニル基(ベンゾチオフェン環上には、ハロゲン原子、ハロゲ ン置換もしくは未置換のC1~6アルキル及びハロゲン置換もしくは未置換のC 20 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基1~3個が置換していてもよ い。)を挙げることができる。

ピリジル基(ピリジン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、フェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲ25 ン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が少なくとも1種が置換していてもよい]、フリル基及びチエニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、無置換の2ーピリジル基、3ーピリジル基、4ーピリジル基、3ーフルオロー2

ーピリジル基、5-フルオロー2-ピリジル基、6-フルオロー2-ピリジル基、 3-クロロー2-ピリジル基、4-クロロー2-ピリジル基、5-クロロー2-ピリジル基、6-クロロー2-ピリジル基、6-クロロー4-メチルー2-ピリ ジル基、3、4、5ートリクロロー2ーピリジル基、3ーメチルー2ーピリジル 基、4-メチル-2-ピリジル基、5-メチル-2-ピリジル基、6-メチル-2-ピリジル基、3-エチル-2-ピリジル基、4-エチル-2-ピリジル基、 5-エチルー2-ピリジル基、6-エチルー2-ピリジル基、3-n-プロピル -2-ピリジル基、4-n-プロピル-2-ピリジル基、5-n-プロピル-2 ーピリジル基、6-n-プロピルー2-ピリジル基、5-tert-ブチルー2 10 ーピリジル基、4-n-ペンチル-2-ピリジル基、5-n-ヘキシル-2-ピ リジル基、6-n-ヘキシル-2-ピリジル基、2-クロロ-3-ピリジル基、 4-クロロー3-ピリジル基、5-クロロー3-ピリジル基、6-クロロー3-ピリジル基、3-ピリジル基、4-ピリジル基、3-メチル-3-ピリジル基、 4-メチルー3-ピリジル基、5-メチルー3-ピリジル基、6-メチルー3-15 ピリジル基、2-エチルー3-ピリジル基、4-エチルー3-ピリジル基、5-エチルー3-ピリジル基、6-エチルー3-ピリジル基、2-プロピルー3-ピ リジル基、4ープロピルー3ーピリジル基、5ープロピルー3ーピリジル基、6 ープロピルー3ーピリジル基、5ーtert-ブチルー3ーピリジル基、4ーペ ンチルー3-ピリジル基、5-ヘキシルー3-ピリジル基、6-ヘキシルー3-ピリジル基、3-クロロー4ーピリジル基、2-クロロー4-ピリジル基、3-20 メチルー4ーピリジル基、2ーメチルー4ーピリジル基、3ートリフルオロメチ ルー4ーピリジル基、3ーエチルー4ーピリジル基、2ーエチルー4ーピリジル 基、3-プロピルー4-ピリジル基、6-n-プロピルー4-ピリジル基、5tertーブチルー4ーピリジル基、2-n-ヘキシルー4ーピリジル基、3-フェニルー2ーピリジル基、4ーフェニルー2ーピリジル基、5ーフェニルー2 25ーピリジル基、6ーフェニルー2ーピリジル基、2ーフェニルー3ーピリジル基、 2-フェニルー4ーピリジル基、2-フェニルー5ーピリジル基、3-(4-フ ルオロフェニル) -2-ピリジル基、3-(3-フルオロ-4-クロロフェニ ル) - 2 - ピリジル基、3 - (3 - フルオロフェニル) - 2 - ピリジル基、3 -

(4ーブロモフェニル) - 4ーピリジル基、3- (3ーフルオロフェニル) - 4 -ピリジル基、4-(2、3、4、5、6-ペンタフルオロフェニル)-2-ピ リジル基、4-(3-フルオロー4-クロロフェニル)-2-ピリジル基、4-(3-フルオロフェニル) -2-ピリジル基、3-(4-クロロフェニル) -2 - ピリジル基、4- (4-クロロフェニル)- 2-ピリジル基、5-(4-クロ ロフェニル) -2-ピリジル基、6-(2,4,6-トリクロロフェニル) -2 -ピリジル基、2-(4-クロロフェニル)-3-ピリジル基、2-(4-クロ ロフェニル)ー4ーピリジル基、6ー(4ークロロフェニル)ー3ーピリジル基、 4- (3-フルオロー4-クロロフェニル) -2-ピリジル基、5- (4-ヨー ドー3ークロロフェニル)ー2ーピリジル基、6一(4ーフルオロー3ークロロ 10 フェニル)-2-ピリジル基、2-(4-フルオロー3-クロロフェニル)-3 ーピリジル基、2-(4-フルオロー3-クロロフェニル)-4-ピリジル基、 6- (4-フルオロー3-クロロフェニル) -3-ピリジル基、5-(4-トリ フルオロメチルフェニル)-2-ピリジル基、6-(4-トリフルオロメチルフ ェニル) -2-ピリジル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル) -3-ピ 15 リジル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)-4-ピリジル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル)-3-ピリジル基、5-(4-メチルフェ ニル) -2-ピリジル基、6-(4-メチルフェニル) -2-ピリジル基、2-(4-メチルフェニル) -3-ピリジル基、2-(4-メチルフェニル) -4-ピリジル基、6-(4-メチルフェニル)-3-ピリジル基、4-フルオロ-2 20 - (4-メトキシフェニル) - 3-ピリジル基、4-メチル-5-フェニル-3 --クロロ--2-ピリジル基、5-(4-メトキシフェニル)-2-ピリジル基、 6- (4-メトキシフェニル) -2-ピリジル基、2- (4-メトキシフェニ ル) -3-ピリジル基、2-(4-メトキシフェニル) -4-ピリジル基、6-(4-メトキシフェニル)-3-ピリジル基、5-(4-トリフルオロメトキシ 25 フェニル)-2-ピリジル基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-2 ピリジル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-3-ピリジル基、 2- (4-トリフルオロメトキシフェニル) -4-ピリジル基、6-(4-トリ フルオロメトキシフェニル)ー3ーピリジル基、5ー(3ークロロー4ートリフ

ルオロメトキシフェニル) -2-ピリジル基、6-(3-クロロ-4-トリフル オロメトキシフェニル) -2-ピリジル基、2-(3-クロロ-4-トリフルオ ロメトキシフェニル) -3-ピリジル基、2-(3-クロロ-4-トリフルオロ メトキシフェニル) -4-ピリジル基、6-(3-クロロ-4-トリフルオロメ トキシフェニル) -3-ピリジル基、5-(3-フルオロ-4-トリフルオロメ トキシフェニル) -2-ピリジル基、6-(3-フルオロ-4-トリフルオロメ トキシフェニル) -2-ピリジル基、2-(3-フルオロ-4-トリフルオロメ トキシフェニル) -3-ピリジル基、2-(3-フルオロ-4-トリフルオロメ トキシフェニル) -4-ピリジル基、6-(3-フルオロ-4-トリフルオロメ トキシフェニル) -3-ピリジル基、5-(3,4-ジメトキシフェニル)-2 10 ーピリジル基、6-(3,4-ジメトキシフェニル)-2-ピリジル基、2-(3, 4-ジメトキシフェニル) -3-ピリジル基、2-(3, 4-ジメトキシ フェニル) -4-ピリジル基、6-(3,4-ジメトキシフェニル)-3-ピリ ジル基、5-(3,4-ジフルオロフェニル)-2-ピリジル基、6-(3,4 ージフルオロフェニル) -2-ピリジル基、2-(3,4-ジフルオロフェニ 15 ル) -3-ピリジル基、2-(3,4-ジフルオロフェニル)-4-ピリジル基、 6-(3,4-ジフルオロフェニル)-3-ピリジル基、5-(3,4-ジクロ ロフェニル) -2-ピリジル基、6-(3,4-ジクロロフェニル)-2-ピリ ジル基、2-(3,4-ジクロロフェニル)-3-ピリジル基、2-(3,4-ジクロロフェニル) -4-ピリジル基、6-(3,4-ジクロロフェニル)-3 20 ーピリジル基、5-(2-フリル)-2-ピリジル基、6-(2-フリル)-2 ーピリジル基、5-(2-フリル)-3-ピリジル基、6-(2-フリル)-3 ーピリジル基、5-(3-フリル)-2-ピリジル基、6-(3-フリル)-2 ーピリジル基、5-(3-フリル)-3-ピリジル基、6-(3-フリル)-3 ーピリジル基、5-(2-チエニル)-2-ピリジル基、6-(2-チエニル) 25 - 2 - ピリジル基、5 - (2 - チエニル) - 3 - ピリジル基、6 - (2 - チエニ ル) -3-ピリジル基、5-(3-チエニル) -2-ピリジル基、6-(3-チ エニル) -2-ピリジル基、5-(3-チエニル) -3-ピリジル基、6-(3 ーチエニル) -3-ピリジル基等のピリジル基(ピリジン環上には、ハロゲン原

子、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基、フェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基が $1\sim5$ 個、好ましくは $1\sim3$ 個置換していてもよい]、フリル基及びチェニル基からなる群より選ばれた基が $1\sim3$ 個が置換していてもよい)を挙げることができる。

フリル基(フラン環上には、C1~6のアルキル基、ニトロ基及びフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6ア ルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6のアルコキシ基及びニトロ基 なる群より選ばれた基が少なくとも1種が置換していてもよい]からなる群より 10 選ばれた基が1~3個置換していてもよい)としては、例えば、2-フリル基、 3-フリル基、3-メチルー2-フリル基、3,4-ジメチルー2-フリル基、 3,4,5ートリメチルー2ーフリル基、4ーメチルー2ーフリル基、5ーメチ ルー2ーフリル基、3ーエチルー2ーフリル基、4ーエチルー2ーフリル基、5 ーエチルー2-フリル基、3-n-プロピルー2-フリル基、4-n-プロピル 15 -2-フリル基、5-n-プロピル-2-フリル基、3-n-ブチル-2-フリ ル基、4-n-ブチルー2-フリル基、5-n-ブチルー2-フリル基、3-n -ペンチル-2-フリル基、4-n-ペンチル-2-フリル基、5-n-ペンチ ルー2-フリル基、3-n-ヘキシル-2-フリル基、4-n-ヘキシル-2-フリル基、5-n-ヘキシル-2-フリル基、2-メチル-3-フリル基、4-20 メチルー3-フリル基、5-メチル-3-フリル基、2-エチルー3-フリル基、 4-エチル-3-フリル基、5-エチル-3-フリル基、2-n-プロピル-3 ーフリル基、4-n-プロピルー3-フリル基、5-n-プロピルー3-フリル 基、2-n-ブチル-3-フリル基、4-n-ブチル-3-フリル基、5-n-ブチルー3ーフリル基、2-n-ペンチルー3-フリル基、4-n-ペンチルー 25 3-フリル基、5-n-ペンチル-3-フリル基、2-n-ヘキシル-3-フリ ル基、4-n-ヘキシル-3-フリル基、5-n-ヘキシル-3-フリル基、3 ーニトロー2ーフリル基、4ーニトロー2ーフリル基、5ーニトロー2ーフリル 基、2-ニトロー3-フリル基、4-ニトロー3-フリル基、3-フェニルー2

ーフリル基、4ーフェニルー2ーフリル基、5ーフェニルー2ーフリル基、3-フェニルー4ーフリル基、4ーフェニルー3ーフリル基、3ー(3ーフルオロフ ェニル) -2-フリル基、4-(3-フルオロフェニル) -2-フリル基、5-(3-フルオロフェニル)-2-フリル基、2-(3-フルオロフェニル)-3 - 一フリル基、3-(2-フルオロフェニル)-2-フリル基、4-(2-フルオ ロフェニル)-2-フリル基、5-(2-フルオロフェニル)-2-フリル基、 2- (2-フルオロフェニル)-3-フリル基、4-ニトロー3-フリル基、3 - (4-フルオロフェニル) - 2-フリル基、4-(4-フルオロフェニル) -2-フリル基、5-(4-フルオロフェニル)-2-フリル基、2-(4-フル オロフェニル)-3-フリル基、4-(4-フルオロフェニル)-3-フリル基、 10 3-(3,4-ジフルオロフェニル)-2-フリル基、4-(2,3,4,5, 6-ペンタフルオロフェニル)-2-フリル基、5-(3,4-ジフルオロフェ (3, 4-i) (3, 4-i) フルオロフェニル (4, 4-i) フルオロフェニル (4, 4-i) フルオロフェニル (4, 4-i) フルオロフェニル (4, 4-i) フェニュー(4, 4-i) フェニュー(4 4-(3,4-ジフルオロフェニル)-3-フリル基、3-(4-クロロフェニ ル)-2-フリル基、4-(4-クロロフェニル)-2-フリル基、5-(4-15 クロロフェニル) -2-フリル基、2-(4-クロロフェニル) -3-フリル基、 ーフリル基、4-(2-クロロフェニル)-2-フリル基、5-(2-クロロフ エニル) -2-フリル基、2-(2-クロロフェニル) -3-フリル基、4-(2-クロロフェニル)-3-フリル基、5-(2-クロロフェニル)-3-フ 20 リル基、3-(3-クロロフェニル)-2-フリル基、4-(3-クロロフェニ ル) -2-フリル基、5-(3-クロロフェニル) -2-フリル基、2-(3-クロロフェニル) -3-フリル基、4-(3-クロロフェニル) -3-フリル基、 3-(3, 4, 5-トリクロロフェニル)-2-フリル基、4-(3, 4-ジク ロロフェニル) - 2 - フリル基、 5 - (3、 4 - ジクロロフェニル) - 2 - フリ 25ル基、2-(3,4-ジクロロフェニル)-3-フリル基、4-(3,4-ジク ロロフェニル) -3-フリル基、3-(4-メチルフェニル) -2-フリル基、 4-(4-メチルフェニル)-2-フリル基、5-(4-メチルフェニル)-2ーフリル基、2- (4ーメチルフェニル) - 3-フリル基、4- (4-メチルフ

ェニル) -3-フリル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル) -2-フリ ル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-フリル基、5-(4-ト リフルオロメチルフェニル) -2-フリル基、2-(4-トリフルオロメチルフ ェニル) -3-フリル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル) -3-フリ ル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)-2-フリル基、4-(2-ト リフルオロメチルフェニル)-2-フリル基、5-(2-トリフルオロメチルフ ェニル) -2-フリル基、2-(2-トリフルオロメチルフェニル) -3-フリ ル基、4-(2-トリフルオロメチルフェニル)-3-フリル基、3-(3-ト リフルオロメチルフェニル)ー2-フリル基、4-(3-トリフルオロメチルフ ェニル) -2-フリル基、5- (4-トリフルオロメチルフェニル) -2-フリ 10 ル基、2-(3-トリフルオロメチルフェニル)-3-フリル基、4-(3-ト リフルオロメチルフェニル)ー3ーフリル基、3ー(2ークロロー5ートリフル オロメチルフェニル) -2-フリル基、4-(2-クロロー5-トリフルオロメ チルフェニル)-2-フリル基、5-(2-クロロ-5-トリフルオロメチルフ ェニル)-2-フリル基、2-(2-クロロ-5-トリフルオロメチルフェニ 15 ル) - 3 - フリル基、4 - (2 - クロロー 5 - トリフルオロメチルフェニル) -3ーフリル基、3ー(4ーメトキシフェニル)-2ーフリル基、4ー(4ーメト キシフェニル)-2-フリル基、5-(4-メトキシフェニル)-2-フリル基、 3-(4-メトキシフェニル)-4-フリル基、4-(4-メトキシフェニル) - 3 - フリル基、3- (2-メトキシフェニル)-2-フリル基、4-(2-メ 20 トキシフェニル) -2-フリル基、5-(2-メトキシフェニル) -2-フリル 基、2-(2-メトキシフェニル)-3-フリル基、4-(2-メトキシフェニ ル) -3-フリル基、3-(2-トリフルオロメトキシフェニル) -2-フリル 基、4-(2-トリフルオロメトキシフェニル)-2-フリル基、5-(2-ト リフルオロメトキシフェニル) -2-フリル基、3-(4-トリフルオロメトキ 25 シフェニル) -2-フリル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル) -2 ーフリル基、5-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-2-フリル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニル) -3-フリル基、4-(4-トリフルオ ロメトキシフェニル) -3-フリル基、3-(3,4-ジメトキシフェニル) -

2-フリル基、4-(3,4-ジメトキシフェニル)-2-フリル基、5-(3,4-ジメトキシフェニル)-2-フリル基、5-(3,4-ジメトキシフェニル)-2-フリル基、5-(3,4-ジメトキシフェニル)-2-フリル基、5-(3,4-ジメトキシフェニル)-2-フリル基、5-(3,4-ジメトキシフェニル)-2-フリル基、5-(3,4-ジメトキシフェニル)-2-フリル基、5-(3,4-ジメトキシフェニル)-2-フリル基、5-(3,4-ジメトキシフェニル)-2-フリル基、5-(3,4-ジメトキシフェニル)-2-フリル基、5-(3,4-ジメトキシフェニル)-2-フリル基、5-(3,4-ジメトキシフェニル)-2-フリル基、5-(3,4-ジメトキシフェニル)-2-フリル基、5-(3,4-ジメトキシフェニル)-2-フリル基、5-(3,4-ジメトキシフェニル)-2-フリル基、5-(3,4-ジメトキシフェニル)-2-フリル基、5-(3,4-ジメトキシフェニル)-2-フリル基、5-(3,4-ジメトキシフェニル)-2-フリル基、5-(3,4-ジメトキシフェニル)-2-(3,4-ジャトキシフェニル)-2-(3,4-ジャトカレ)-2-(3,4-ジャトカレ)-2-(3,4-ジャトカレ)-2-(4,4-ジャトカレ)4ージメトキシフェニル)-2-フリル基、3-(3,4-ジメトキシフェニ ル) -3-フリル基、4-(3,4-ジメトキシフェニル)-3-フリル基、3 - (4-ニトロフェニル) - 2 - フリル基、4- (4-ニトロフェニル) - 2 -フリル基、5-(4-ニトロフェニル)-2-フリル基、2-(4-ニトロフェ ニル) -3-フリル基、4-(4-ニトロフェニル) -3-フリル基、3-(3 ーニトロフェニル) -2-フリル基、4-(3-ニトロフェニル) -2-フリル 基、5-(3-ニトロフェニル)-2-フリル基、2-(3-ニトロフェニル) - 3 - フリル基、 4 - (3 - ニトロフェニル) - 3 - フリル基、 4 - メチル - 5 -ニトロー2-フリル基、4-フェニルー3,5-ジメチル-2-フリル基等の 10 フリル基(フラン環上には、C1~6のアルキル基、ニトロ基及びフェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6ア ルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6のアルコキシ基及びニトロ基 なる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい)か らなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。 15 ベンゾチアゾール基(ベンゾチアゾール環上には、置換基としてフェニル環上 にC1~6のアルコキシ基を有することのあるフェニル基が少なくとも1個置換 していてもよい。)としては、例えば、ベンゾチアゾール-2-イル基、ベンゾ チアゾールー4-イル基、ベンゾチアゾールー5-イル基、ベンゾチアゾールー 20 6-イル基、ベンゾチアゾール-7-イル基、2-フェニルベンゾチアゾール-4-イル基、2、5-ジフェニルベンゾチアゾール-4-イル基、4、5、6-トリフェニルベンゾチアゾールー2ーイル基、2-フェニルベンゾチアゾールー 5ーイル基、2ーフェニルベンゾチアゾールー6ーイル基、2ーフェニルベンゾ チアゾールー7-イル基、2-(3-エトキシフェニル)ベンゾチアゾール-7 25 ーイル基、2-(4ープロポキシフェニル)ベンゾチアゾールー4ーイル基、2 - (4-n-ブトキシフェニル)ベンゾチアゾール-5-イル基、2-(4-n ーヘキシルオキシフェニル) ベンゾチアゾール-6-イル基、2-(4-n-ペ ンチルオキシフェニル) ベンゾチアゾールー7-イル基、4-フェニルベンゾチ アゾールー2ーイル基、5ーフェニルベンゾチアゾールー2ーイル基、6ーフェ

ニルベンゾチアゾールー2ーイル基、7ーフェニルベンゾチアゾールー2ーイル 基、4ー(3,4ージメトキシフェニル)ベンゾチアゾールー2ーイル基、5ー (3,4,5ートリメトキシフェニル)ベンゾチアゾールー2ーイル基、7ー (3ーメトキシフェニル)ベンゾチアゾールー2ーイル基、4ー(4ーメトキシ 5 フェニル)ベンゾチアゾールー2ーイル基、5ー(4ーメトキシフェニル)ベン ゾチアゾールー2ーイル基、6ー(4ーメトキシフェニル)ベンゾチアゾールー 2ーイル基、7ー(4ーメトキシフェニル)ベンゾチアゾールー2ーイル基等の ベンゾチアゾール基(ベンゾチアゾール環上には、置換基としてフェニル環上に C1~6のアルコキシ基を1~3個有することのあるフェニル基を1~3個有し ていてもよい。)を挙げることができる。

チエニル基(チオフェン環上には、ハロゲン原子、ニトロ基、C1~6アルキ ル基、ピラゾール環上に置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のC1~6ア ルキル基が少なくとも1個置換していてもよいピラゾリル基及びチオフェン環上 にハロゲン原子を有していてもよいチエニル基からなる群より選ばれた基の少な 15 くとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、2-チエニル基、3-フ ルオロー2-チエニル基、4-フルオロー2-チエニル基、5-フルオロー2-チエニル基、3-クロロ-2-チエニル基、4-クロロ-2-チエニル基、5-クロロー2ーチエニル基、3ーブロモー2ーチエニル基、4ーブロモー2ーチエ ニル基、5-ブロモー2-チエニル基、3-チエニル基、2-フルオロー3-チ エニル基、4-フルオロー3-チエニル基、5-フルオロー3-チエニル基、2 ークロロー3ーチエニル基、4ークロロー3ーチエニル基、5ークロロー3ーチ エニル基、2-ブロモー3-チエニル基、4-ブロモー3-チエニル基、5-ブ ロモー3ーチエニル基、3ーニトロー2ーチエニル基、4ーニトロー2ーチエニ ル基、5-ニトロー2-チエニル基、2-ニトロー3-チエニル基、4-ニトロ - 3ーチエニル基、5ーニトロー3ーチエニル基、3ーメチルー2ーチエニル基、 25 4-メチル-2-チエニル基、5-メチル-2-チエニル基、5-エチル-2-チエニル基、2-メチル-3-チエニル基、4-メチル-3-チエニル基、5-メチルー3ーチエニル基、2,5ージメチルー3ーチエニル基、2,4,5ート リメチルー3ーチエニル基、2、4ージメチルー3ーチエニル基、3ー(ピラゾ

ールーイル) -2-チエニル基、4-(ピラゾール-1-イル) -2-チエニル 基、5-(ピラゾールー1-イル)-2-チエニル基、2-(ピラゾール-1-イル)-3-チエニル基、4-(ピラゾール-1-イル)-3-チエニル基、5 - (ピラゾール-1-イル) - 3-チエニル基、3-(3-トリフルオロメチル ピラゾールーイル)-2-チエニル基、4-(3-トリフルオロメチルピラゾー ルー1ーイル) -2-チエニル基、5-(1-メチル-3-トリフルオロメチル ピラゾール-5-イル)-2-チエニル基、2-(1,4,5-トリメチルピラ ゾールー3ーイル) -3-チエニル基、4-(1,5-ジメチルピラゾール-3 ーイル) -3-チエニル基、5-(1-メチルーピラゾール-3-イル) -3-チエニル基、5-(1-n-ペンチルーピラゾール-5-イル)-2-チエニル 10 基、5-(1-n-ヘキシルーピラゾール-5-イル)-2-チエニル基、3-(5-トリフルオロメチルピラゾールーイル) -2-チエニル基、4-(5-n ープロピルーピラゾールー1ーイル) -2-チエニル基、5-(5-n-ブチル ーピラゾールー1ーイル) -2-チエニル基、2-(5-トリフルオロメチルピ 15 ラゾールー1ーイル) -3-チエニル基、4-(5-エチルーピラゾール-1-イル) -3-チエニル基、5-(5-トリフルオロメチルピラゾール-1-イ ル) -3-チエニル基、3-(2-チエニル) -2-チエニル基、4-(2-チ エニル) -2-チエニル基、3-クロロ-4-(2-チエニル) -2-チエニル 基、5-(2-チエニル)-2-チエニル基、2-(2-チエニル)-3-チエ 20 ニル基、4-(2-チエニル)-3-チエニル基、5-(2-チエニル)-3-チエニル基、3-(5-クロロ-2-チエニル)-2-チエニル基、4-(5-ブロモー2ーチエニル) -2-チエニル基、5-(5-クロロー2-チエニル) -2-チエニル基、2-(5-クロロ-2-チエニル)-3-チエニル基、4-(5-クロロー2ーチエニル) -3-チエニル基、5-(5-クロロー2ーチエ ニル) -3-チエニル基、3-(4-クロロ-2-チエニル) -2-チエニル基、 25 4-(3,4-ジクロロ-2-チエニル)-2-チエニル基、5-(3,4,5 ートリクロロー2ーチエニル) -2ーチエニル基、2-(4ーブロモー2ーチエ ニル) -3-チエニル基、4-(4-クロロ-2-チエニル) -3-チエニル基、 5- (4-ブロモー2-チエニル) -3-チエニル基等のチエニル基 (チオフェ

ン環上には、ハロゲン原子、ニトロ基、C1~6アルキル基、ピラゾール環上に 置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基が1~3個置換 していてもよいピラゾリル基及びチオフェン環上にハロゲン原子を1~3個有していてもよいチエニル基からなる群より選ばれた基を1~3個有していてもよい、) を光げることができる

5 い。)を挙げることができる。 インドリル基(インドール環上には、置換基としてC1~6アルキル基を有す ることのあるフェニルスルホニル基、フェニルC1~6アルキル基、C1~6ア ルコキシカルボニル基及びフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1 種が置換していてもよい)としては、例えば、インドールー1ーイル、インドー - ルー2-イル、インドールー3-イル、インドールー4-イル、インドールー5 ーイル、インドールー6ーイル、インドールー7ーイル、1-(ベンゼンスルホ ニル) インドールー3-イル基、1-(4-メチルベンゼンスルホニル) インド ールー3-イル基、1-(3,4-ジメチルベンゼンスルホニル)インドールー 3-イル基、1-(3,4,6-トリメチルベンゼンスルホニル)インドールー 3-イル基、1-ベンジルインドール-3-イル基、1-(2-フェネチル)イ 15 ンドールー3-イル基、1-(1-フェネチル)インドールー3-イル基、1-(3-フェニルプロピル) インドール-3-イル基、1-(4-フェニルブチ ル) インドールー3ーイル基、1-(5-フェニルペンチル) インドールー3-イル基、1-(6-フェニルヘキシル)インドール-3-イル基、6-メトキシ カルボニルインドールー3ーイル基、6-エトキシカルボニルインドールー3ー 20 イル基、6-n-プロポキシカルボニルインドール-3-イル基、6-n-ブト キシカルボニルインドールー3-イル基、6-n-ペンチルオキシカルボニルイ ンドールー3-イル基、6-n-ヘキシルオキシカルボニルインドールー3-イ ル基、2-フェニルインドールー3-イル基、1-ベンジルー6-フェニルー6 - - メトキシカルボニルインドールー3-イル基、1-ベンジルー6-メトキシカ 25 ルボニルインドールー3-イル基、2-フェニル-1-(4-メチルベンゼンス ルホニル)インドールー3-イル基等のインドリル基(インドール環上には、置 換基としてC1~6アルキル基を1~3個有することのあるフェニルスルホニル 基、フェニルC1~6アルキル基、C1~6アルコキシカルボニル基及びフェニ ル基からなる群より選ばれた基が $1 \sim 3$ 個置換していてもよい。)を挙げることができる。

ピロリル基 (ピロール環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のС1~6アル キル基が少なくとも1個置換していてもよいフェニル基及びC1~6アルキル基 からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、 例えば、2-ピロリル基、1-メチルー2-ピロリル基、1-エチルー2-ピロ リル基、1-n-プロピルー2-ピロリル基、1-n-ブチルー2-ピロリル基、 1-n-ペンチル-2-ピロリル基、1-n-ヘキシル-2-ピロリル基、3-ピロリル基、1-メチル-3-ピロリル基、1-エチル-3-ピロリル基、1n-プロピル-3-ピロリル基、1-n-ブチル-3-ピロリル基、1-n-ペ 10 ンチルー3ーピロリル基、1-n-ヘキシルー3ーピロリル基、2,5-ジメチ ルー3ーピロリル基、1-(3-メチルフェニル)-2.5-ジメチル-3-ピ ロリル基、1-(4-メチルフェニル)-2,5-ジメチル-3-ピロリル基、 1-(3-トリフルオロメチルフェニル)-2,5-ジメチル-3-ピロリル基、 1-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2,5-ジメチル-3-ピロリル基、 15 1-(2,3-ジメチルフェニル)-3-ピロリル基、1-(4-メチルフェニ ル) -3-ピロリル基、1-(3-トリフルオロメチルフェニル) -3-ロリル 基、1-(4-トリフルオロメチルフェニル)-3-ピロリル基、1-(3-メ チルフェニル)-3,5-ジメチル-2-ピロリル基、1-(4-メチルフェニ 20 ル)-3、5-ジメチル-2-ピロリル基、1-(3-トリフルオロメチルフェ ニル)-3,5-ジメチルー2-ピロリル基、1-(4-トリフルオロメチルフ ェニル) -3, 5-ジメチル-2-ピロリル基、1-(3-メチルフェニル) -2-ピロリル基、1-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2-ピロリル基、 1-(3,5-ジトリフルオロメチルフェニル)-2-ピロリル基、1-(4-トリフルオロメチルフェニル) -2-ピロリル基等のピロリル基(ピロール環上 25 には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基が1~3個置換するこ とのあるフェニル基及びC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基が1~3 個置換していてもよい)を挙げることができる。

クマリル基は、4ークマリル基、5ークマリル基、6ークマリル基、7ークマ

リル基及び8-クマリル基を含む。

い)を挙げることができる。

ベンゾイミダゾリル基(ベンゾイミダゾール環上には、少なくとも1個のチェニル基が置換していてもよい)としては、例えば、2ーベンゾイミダゾリル基、4ーベンゾイミダゾリル基、5ーベンゾイミダゾリル基、6ーベンゾイミダゾリ 5 ル基、2ー(2ーチエニル)ー4ーベンゾイミダゾリル基、2ー(2ーチエニル)ー5ーベンゾイミダゾリル基、2ー(2ーチエニル)ー6ーベンゾイミダゾリル基、2ー(3ーチエニル)ー5ーベンゾイミダゾリル基、2ー(3ーチエニル)ー4ーベンゾイミダゾリル基、2ー(3ーチエニル)ー5ーベンゾイミダゾリル基、2ー(3ーチエニル)ー5ーベンゾイミダゾリル基、2ー(3ーチエニル)ー6ーベンゾイミダゾリル基、2ー(3ーチエニル)ル)ー7ーベンゾイミダゾリル基等を挙げることができる。

オキサゾリル基(オキサゾール環上には、ハロゲン原子を有することのあるフ ェニル基が少なくとも1個置換していてもよい)としては、例えば、2ーオキサ ゾリル基、4-オキサゾリル基、5-オキサゾリル基、2-フェニルー4-オキ サゾリル基、2-(4-フルオロフェニル)-4-オキサゾリル基、2,4-ジ (4-クロロフェニル)-5-オキサゾリル基、2-(4-クロロフェニル)-**1**5 4-オキサゾリル基、2-(4-ブロモフェニル)-4-オキサゾリル基、2-(4-ヨードフェニル) -4-オキサゾリル基、2-(4-フルオロフェニル) - 5 - オキサゾリル基、2 - (4 - クロロフェニル) - 5 - オキサゾリル基、2 - (4-ブロモフェニル) - 5-オキサゾリル基、2- (4-ヨードフェニル) - 5 - オキサゾリル基、2-(4-フルオロフェニル)-4-オキサゾリル基、 20 2-(3,4-クロロフェニル)-4-オキサゾリル基、2-(4-ブロモフェ ニル) -5-オキサゾリル基、2- (4-ヨードフェニル) -5-オキサゾリル 基、2-(2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニル)-4-オキサゾリル 基、2−(2,4,6−トリクロロフェニル)−4−オキサゾリル基、2−(4 - 一ブロモフェニル)-5-オキサゾリル基、2-(4-ヨードフェニル)-5-25オキサゾリル基等のオキサゾリル基(オキサゾール環上には、ハロゲン原子を1 ~ 5 個有することのあるフェニル基を置換基として 1 ~ 2 個が置換していてもよ

チアゾリル基 (チアゾール環上には、少なくとも1個のフェニル基が置換して

いてもよい。該フェニル環上には、ハロゲン原子、ニトロ基及びフェニル基から なる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。)としては、例 えば、2-チアゾリル基、4-チアゾリル基、5-チアゾリル基、2-フェニル - 4 - チアゾリル基、2 - フェニル - 5 - チアゾリル基、2, 4 - ジフェニル -5-チアゾリル基、2、5-ジフェニルー4-チアゾリル基、2-(4-クロロ フェニル)-4-チアゾリル基、2-(4-フルオロフェニル)-5-チアゾリ ル基、2- (2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニル)- 4-チアゾリル 基、2-(4-ブロモフェニル)-4-チアゾリル基、2-(3、4-ジクロロ フェニル)-4-チアゾリル基、2-(3,4-ジクロロフェニル)-5-チア 10 - ブリル基、2-(3,4-ジフルオロフェニル)-5-チアブリル基、2-(2. 4,6-トリクロロフェニル)-4-チアゾリル基、2-(3-クロロー4-ニ トロフェニル) -4-チアゾリル基、2-(4-フェニル-3-ブロモフェニ ル) - 4 - チアゾリル基、2 - (4 - ニトロフェニル) - 4 - チアゾリル基、2 - (4-ニトロフェニル) - 5 - チアゾリル基、2 - (2, 4, 6 - トリニトロ 15 フェニル)-5-チアゾリル基、2-(2,4-ジニトロフェニル)-4-チア ゾリル基、2-(4-ビフェニリル)-4-チアゾリル基、2-(4-ビフェニ リル) -5-チアゾリル基、4-(4-ビフェニリル) -2-チアゾリル基、2 (4ービフェニリル)-4ーチアゾリル基等のチアゾリル基(チアゾール環上 には、ハロゲン原子、ニトロ基及びフェニル基からなる群より選ばれた基が1~ 20 5個、好ましくは1~3個置換していてもよいフェニル基が1~2個置換してい てもよい。)を挙げることができる。

キノリル基は、2-キノリル基、3-キノリル基、4-キノリル基、5-キノリル基、6-キノリル基、7-キノリル基及び8-キノリル基を含む。

3, 4ージヒドロカルボスチリル基(3, 4ージヒドロカルボスチリル環上に 25 は、C1~6アルコキシ基、C1~6アルキル基及びフェニルC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)及びカルボスチリル基(カルボスチリル環上には、C1~6アルコキシ基、C1~6アルキル基及びフェニルC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、3, 4ージヒドロカルボス

チリルー1ーイル基、3、4ージヒドロカルボスチリルー3ーイル基、3、4ー ジヒドロカルボスチリルー4ーイル基、3、4ージヒドロカルボスチリルー5ー イル基、3、4ージヒドロカルボスチリルー6ーイル基、3、4ージヒドロカル ボスチリルー7-イル基、3,4-ジヒドロカルボスチリルー8-イル基、カル ボスチリルー1ーイル基、カルボスチリルー3ーイル基、カルボスチリルー4ー イル基、カルボスチリルー5-イル基、カルボスチリルー6-イル基、カルボス チリルー7ーイル基、カルボスチリルー8ーイル基、6ーメトキシー3,4ージ ヒドロカルボスチリルー5ーイル基、7-メトキシー3,4-ジヒドロカルボス チリル-5-イル基、8-メトキシ-3,4-ジヒドロカルボスチリル-5-イ ル基、8-メトキシ-1-メチル-3, 4-ジヒドロカルボスチリル-5-イル 10 基、8-ベンジルオキシー3,4-ジヒドロカルボスチリルー5-イル基、8-メトキシカルボスチリルー5ーイル基、8ーメトキシー1ーメチルカルボスチリ ルー5ーイル基、8ーベンジルオキシカルボスチリルー5ーイル基、8ーメトキ シー3.4ージヒドロカルボスチリルー6ーイル基、6ーメチルー3,4ージヒ ドロカルボスチリルー5ーイル基、6、7ージメチルー3,4ージヒドロカルボ 15 スチリルー5ーイル基、1,5,6ートリメチルー3,4ージヒドロカルボスチ リルー7-イル基、6-メチルカルボスチリルー5-イル基、6、7-ジメチル カルボスチリルー5-イル基、1,5,6-トリメチルカルボスチリルー7ーイ ル基、8-メトキシー1-メチルー3,4-ジヒドロカルボスチリルー6-イル 基、8ーベンジルオキシー3、4ージヒドロカルボスチリルー6ーイル基、8ー 20 メトキシカルボスチリルー6ーイル基、8ーメトキシー1ーメチルカルボスチリ ルー6ーイル基、8ーベンジルオキシカルボスチリルー6ーイル基、8ーメトキ シー3,4-ジヒドロカルボスチリルー7ーイル基、8-メトキシー1-メチル - 3, 4-ジヒドロカルボスチリル-7-イル基、8-ベンジルオキシ-3, 4 ージヒドロカルボスチリルー7ーイル基、8-エトキシカルボスチリルー7ーイ 25 ル基、8-メトキシ-1-プロピルカルボスチリル-7-イル基、8-(2-フ ェニルエトキシ) カルボスチリルー7ーイル基等の3, 4ージヒドロカルボスチ リル基(3、4-ジヒドロカルボスチリル環上には、C1~6アルコキシ基、C 1~6アルキル基及びフェニルC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基 が $1\sim3$ 個置換していてもよい)及びカルボスチリル基(カルボスチリル環上には、 $C1\sim6$ アルコキシ基、 $C1\sim6$ アルキル基及びフェニル $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基が $1\sim3$ 個置換していてもよい。)を挙げることができる。

5 イミダゾ [2, 1-b] チアゾリル基としては、例えば、6-イミダゾ [2, 1-b] チアゾリル基、5-イミダゾ [2, 1-b] チアゾリル基、3-イミダゾ [2, 1-b] チアゾリル基等を挙げることができる。

イミダゾ $\begin{bmatrix} 2 & 1-a \end{bmatrix}$ ピリジル基としては、例えば、2-イミダゾ $\begin{bmatrix} 2 & 1 \end{bmatrix}$ $\begin{bmatrix} 1 & 1$

クロマニル基(クロマン環上には、少なくとも1個のC1~6アルキル基が置換していてもよい)としては、例えば、2-メチル-5-クロマニル基、2,2

15 ージメチル-5-クロマニル基、2-メチル-6-クロマニル基、2-エチル-6-クロマニル基、2-n-プロピル-6-クロマニル基、2-n-ブチル-6-クロマニル基、2-n-ベンチル-6-クロマニル基、2-n-ベキシル-6-クロマニル基、2,2-ジメチル-6-クロマニル基、2,2-ジエチル-6-クロマニル基、2,2-ジメチル-7-クロマニル基、2,2-ジメチル-7-クロマニル基、2,2-ジメチル-7-クロマニル基、2,2・ジメチル-7-クロマニル基、2,2・ジメチル-8-クロマニル基、2,2・ジメチル-8-クロマニル基、2,2・ジメチル-8-クロマニル基、2,2・ジメチル-8-クロマニル基等のクロマニル基(クロマン環上にはC1~6アルキル基が1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

2, 3-ジヒドロベンゾフリル基としては、例えば、2, 3-ジヒドロ-4-25 ベンゾフリル基、2, 3-ジヒドロ-5-ベンゾフリル基、2, 3-ジヒドロ-6-ベンゾフリル基、2, 3-ジヒドロ-7-ベンゾフリル基等を挙げることができる。

アミノ置換C1~6アルキル基 [アミノ基上には、フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロ

ゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少 なくとも1種が置換していてもよい)及びC1~6アルキル基なる群より選ばれ た基の少なくとも1種が置換していてもよい]としては、例えば、アミメチル基、 2-アミノエチル基、1-アミノエチル基、3-アミノプロピル基、4-アミノ ブチル基、5ーアミノペンチル基、6ーアミノヘキシル基、2ーメチルー3ーア ミノプロピル基、1、1ージメチルー2ーアミノエチル基、2ー(メチルアミ ノ) エチル基、3-(メチルアミノ)プロピル基、4-(メチルアミノ)ブチル 基、5-(メチルアミノ)ペンチル基、6-(メチルアミノ)ヘキシル基、ジメ チルアミノメチル基、2-(ジエチルアミノ)エチル基、3-(ジn-プロピル アミノ) プロピル基、4-(ジn-ブチルアミノ)ブチル基、5-(ジn-ペン チルアミノ)ペンチル基、2-(ジェーヘキシルアミノ)ヘキシル基、アニリノ メチル基、2- (N-メチルアニリノ) エチル基、3- (N-メチルアニリノ) プロピル基、4-アニリノブチル基、2- (N-メチル-4-クロロアニリノ) エチル基、3- (N-メチル-4-クロロアニリノ) プロピル基、4- (N-メ チルー4-クロロアニリノ) ブチル基、2- (N-メチルー4-フルオロアニリ 15 ノ) エチル基、3-(N-メチル2,3,4,5,6-ペンタフルオロアニリ ノ)プロピル基、2- (3 - フルオロアニリノ)エチル基、3 - (N - メチル-3-フルオロアニリノ)プロピル基、4-(3-フルオローアニリノ)ブチル基、 2- (N-メチル-2-フルオロアニリノ) エチル基、3- (2-フルオロアニ リノ)プロピル基、4ー(N-メチル-2-フルオロアニリノ)ブチル基、2-20 (N-メチル-2-クロロアニリノ) エチル基、3-(N-メチル-2-クロロ アニリノ)プロピル基、4-(N-メチル-2-クロロアニリノ)ブチル基、2 - (N-メチル-2, 3-ジクロロアニリノ) エチル基、3-(N-メチル-2, 4, 6-トリクロロアニリノ) プロピル基、4-(N-メチル-3-クロロアニ リノ) ブチル基、2- (N-メチル-4-トリフルオロメチルアニリノ) エチル 25 基、2-(4-メチルアニリノ)エチル基、2-(N-エチル-3,5-ジトリ フルオロメチルアニリノ) エチル基、2-(N-メチル-3, 5-ジトリフルオ ロメチルアニリノ) エチル基、2-(N-メチル-2, 4-ジメチルアニリノ) エチル基、2-(N-メチル-3, 5-ジメトキシアニリノ) エチル基、2-

(2, 4, 6-トリメチルアニリノ) エチル基、2-(3, 4, 5-トリメトキ シアニリノ) エチル基、3- (N-メチル-4-トリフルオロメチルアニリノ) プロピル基、4-(N-メチル-4-トリフルオロメチルアニリノ)ブチル基、 2- (N-メチル-3-トリフルオロメチルアニリノ) エチル基、3- (N-メ チルー3-トリフルオロメチルアニリノ)プロピル基、2-(N-メチルー2-トリフルオロメチルアニリノ) エチル基、3-(N-メチル-2-トリフルオロ メチルアニリノ)プロピル基、4-(N-メチル-2-トリフルオロメチルアニ リノ) ブチル基、2-(N-メチル-4-トリフルオロメトキシアニリノ) エチ ル基、3-(N-メチル-4-トリフルオロメトキシアニリノ)プロピル基、4 (4-トリフルオロメトキシアニリノ)ブチル基、2-(Nーメチルー3ート 10 リフルオロメトキシアニリノ) エチル基、3-(N-メチル-3-トリフルオロ メトキシアニリノ)プロピル基、4-(N-メチル-3-トリフルオロメトキシ アニリノ) ブチル基、2- (N-メチル-2-トリフルオロメトキシアニリノ) エチル基、3-(N-メチル-2-トリフルオロメトキシアニリノ)プロピル基、 4- (N-メチル-2-トリフルオロメトキアニリノ) ブチル基、2- (N-メ 15 チル-4-メトキシアニリノ) エチル基、3-(N-メチル-4-メトキシアニ リノ)プロピル基、4-(N-メチル-4-メトキシアニリノ)ブチル基、2-(N-メチル-3-メトキシアニリノ) エチル基、3-(N-メチル-3-メト キシアニリノ)プロピル基、4-(3-メトキシアニリノ)ブチル基、2-(2 -メトキシアニリノ) エチル基、3-(N-メチル-2-メトキシアニリノ) プ 20 ロピル基、4- (N-メチル-2-メトキシアニリノ)ブチル基等の置換基とし てフェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基か らなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは、1~3個置換していてもよ い。)及びC1~6アルキル基なる群より選ばれた基を1~2個有することのあ 25

1, 4-ジオキサアザスピロ [4, 5] デシル基(1, 4-ジオキサアザスピロ [4, 5] デカン環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい)としては、例えば、1, 4-ジオキサ-8-アザスピロ [4, 5] デシ-8

るアミノ置換C1~6アルキル基を挙げることができる。

-イル基、7-オキソー1, 4-ジオキサー8-アザスピロ [4, 5] デシー8 -イル基、6-オキソー1, 4-ジオキサー8-アザスピロ [4, 5] デシー8 -イル基等を挙げることができる。

ホモピペラジニル基(ホモピペラジン環上には、C1~6アルコキシカルボニ ル基、フェニルC1~6アルコキシカルボニル基及びフェニル置換もしくは未置 換のフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよ い)としては、例えば、1-ホモピペラジニル基、2-ホモピペラジニル基、3 ーホモピペラジニル基、4ーホモピペラジニル基、5ーホモピペラジニル基、6 ーホモピペラジニル基、7ーホモピペラジニル基、4ーメトキシカルボニルー1 10 - ホモピペラジンニル基、4-エトキシカルボニル-1-ホモピペラジンニル基、 4-n-プロポキシカルボニル-1-ホモピペラジンニル基、4-tert-ブ トキシカルボニルー1ーホモピペラジンニル基、4-nーペンチルオキシカルボ ニルー1-ホモピペラジンニル基、4-n-ヘキシルオキシカルボニル-1-ホ モピペラジンニル基、4-ベンジルオキシカルボニル-1-ホモピペラジンニル 基、4-(2-フェニルエトキシカルボニル)-1-ホモピペラジンニル基、4 15 - (3-フェニルプロポキシカルボニル)-1-ホモピペラジンニル基、4-(4-フェニルブトキシカルボニル) -1-ホモピペラジンニル基、4-(5-フェニルペンチルオキシカルボニル)-1-ホモピペラジンニル基、4-(6-フェニルヘキシルオキシカルボニル)-1-ホモピペラジンニル基、4-(4-ビフェニリル) -1-ホモピペラジニル基、3,4-ジフェニル-1-ホモピペ 20 ラジニル基、3、4、5ートリフェニルー1ーホモピペラジニル基、3ーフェニ ルー4-メトキシカルボニルー1-ホモピペラジニル基等のホモピペラジニル基 (ホモピペラジン環上には、C1~6アルコキシカルボニル基、フェニルC1~ 6アルコキシカルボニル基及びフェニル置換もしくは未置換のフェニル基からな 25る群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい。)を挙げることができる。

ピペラジニル基(ピペラジン環上には、オキソ基、C1~6アルキル基、フェニルC1~6アルキル基 [フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基の少なくとも1個が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] としては、例えば、ピペラジン

-1-イル基、ピペラジン-2-イル基、ピペラジン-3-イル基、ピペラジン - 4 - イル基、1 - メチルーピペラジン- 4 - イル基、1 - ベンジルーピペラジ ンー4-イル基、1,2-ジメチルーピペラジン-4-イル基、1-ベンジル-2,6-ジメチルーピペラジンー4-イル基、1-エチルー2-オキソピペラジ ンー4-イル基、1-n-プロピルー2-オキソピペラジンー4-イル基、1-イソプロピルー2ーオキソピペラジンー4ーイル基、1-nーブチルー2ーオキ ソピペラジンー4ーイル基、1ーtert-ブチルー2ーオキソピペラジンー4 ーイル基、1-n-ペンチル-2-オキソピペラジン-4-イル基、1-n-ヘ キシル-2-オキソピペラジン-4-イル基、1-(4-ベンジル)-2-オキ ソピペラジンー4ーイル基、1ー(2、4ージメチルベンジル) ピペラジンー4 10 ーイル基、1-(2,4,6-トリメチルベンジル)ピペラジン-4-イル基、 1-(3,5-ジトリフルオロメチルベンジル)ピペラジン-4-イル基、1-(4-メチルベンジル) -2-オキソピペラジン-4-イル基、1-(4-トリ フルオロメチルベンジル)-2-オキソピペラジン-4-イル基、1-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチル]-2-オキソピペラジン-4-イ 15 ル基、1-「3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロピル]-2-オキソ ピペラジン-4-イル基、1-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ブチ ル] -2-オキソピペラジン-4-イル基、1-[5-(4-トリフルオロメチ ルフェニル)ペンチル]-2-オキソピペラジン-4-イル基、1-[6-(4 ートリフルオロメチルフェニル)ヘキシル]-2-オキソピペラジン-4-イル 20 基等のピペラジニル基(ピペラジン環上には、オキソ基、C1~6アルキル基、 フェニルC1~6アルキル基 [フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換 のC1~6アルキル基が1~3個置換していてもよい] からなる群より選ばれた 基が1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

25 ピペリジル基(ピペリジン環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい)としては、例えば、1-ピペリジル基、2-ピペリジル基、3-ピペリジル基、4-ピペリジル基、2-オキソ-1-ピペリジル基、3-オキソ-1-ピペリジル基、4-オキソ-1-ピペリジル基等を挙げることができる。 ピロリジニル基(ピロリジン環上には、置換基としてハロゲン置換もしくは未

置換のC1~6アルコキシ基を有することのあるフェノキシC1~6アルキル基 が少なくとも1個置換していてもよい)としては、例えば、ピロリジン-1-イ ル基、ピロリジンー2-イル基、ピロリジン-3-イル基、2-フェノキシメチ ルピロリジン-1-イル基、3-フェノキシメチルピロリジン-1-イル基、2 5 - (2, 4-ジメトキシフェノキシメチル)ピロリジン-1-イル基、2-(2, 4. 6-トリメトキシフェノキシメチル)ピロリジン-1-イル基、2,3-ジ フェノキシメチルピロリジン-1-イル基、1、3、4-フェノキシメチルピロ リジン-2-イル基、2-(4-メトキシフェノキシメチル)ピロリジン-1-イル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシメチル)ピロリジン-1-イル基、2-[2-(3-トリフルオロメトキシフェノキシ)エチル] ピロリジ 10 ン-1-イル基、2-[3-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)プロピ ル] ピロリジン-1-イル基、2-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキ シ) ブチル] ピロリジン-1-イル基、2-[5-(4-トリフルオロメトキシ フェノキシ) ペンチル] ピロリジン-1-イル基、2-[6-(4-トリフルオ ロメトキシフェノキシ) ヘキシル] ピロリジン-1-イル基、3-(4-メトキ 15 シフェノキシメチル)ピロリジン-1-イル基、3-(3-トリフルオロメトキ シフェノキシメチル)ピロリジンー1ーイル基、3-(4ートリフルオロメトキ シフェノキシメチル) ピロリジンー1ーイル基等のピロリジニル基(ピロリジン 環上には、置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基を 1~3個有することのあるフェノキシC1~6アルキル基が1~3個置換してい 20 てもよい)を挙げることができる。

イソインドリニル基としては、例えば、2-イソインドリニル基、1-イソインドリニル基、3-イソインドリニル基、4-イソインドリニル基、5-イソインドリニル基、6-イソインドリニル基等を挙げることができる。

25 オキサゾリジニル基 (オキサゾリジン環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい) としては、例えば、2ーオキサゾリジニル基、3ーオキサゾリジニル基、5ーオキサブリジニル基、2ーオキソー3ーオキサブリジニル基等を挙げることができる。

ベンゾー1,3-オキサゾリジニル基(ベンゾー1,3-オキサゾリジン環上

には、置換基としてオキソ基、ハロゲン原子及びフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、ベンゾー1、3ーオキサゾリジンー2ーイル基、ベンゾー1、3ーオキサゾリジンー3ーイル基、ベンゾー1、3ーオキサゾリジンー4ーイル基、ベンゾー1、3ーオキサゾリジンー6ーイル基、ベンゾー1、3ーオキサゾリジンー6ーイル基、ベンゾー1、3ーオキサゾリジンー7ーイル基、2ーオキソベンゾー1、3ーオキサゾリジンー3ーイル基、4ークロロー2ーオキソベンゾー1、3ーオキサゾリジンー3ーイル基、5ープロモー2ーオキソベンゾー1、3ーオキサゾリジンー3ーイル基、5ープロモー2ーオキソベンゾー1、3ーオキサゾリジンー3ーイル基、5ープロモー2ーオキソベンゾー1、3ーオキサゾリジンー3ーイル基、

- 10 5-フルオローベンゾー1,3-オキサゾリジン-3-イル基、6-フェニルーベンゾー1,3-オキサゾリジン-3-イル基、5-ブロモ-6-フェニル-2-オキソベンゾー1,3-オキサゾリジン-3-イル基、6-クロロ-2-オキソベンゾー1,3-オキサゾリジン-3-イル基、7-クロロ-2-オキソベンゾー1,3-オキサゾリジン-3-イル基、5-ブロモ-2-オキソベンゾー1,
- 15 3ーオキサゾリジン-3ーイル基、4ーフェニル-2ーオキソベンゾー1,3ーオキサゾリジン-3ーイル基、5ーフェニル-2ーオキソベンゾー1,3ーオキサゾリジン-3ーイル基、6ーフェニル-2ーオキソベンゾー1,3ーオキサゾリジン-3ーイル基、7ーフェニル-2ーオキソベンゾー1,3ーオキサゾリジン-3ーイル基等のベンゾー1,3ーオキサゾリジニル基(ベンゾー1,3ーオ
- 20 キサゾリジン環上には、オキソ基、ハロゲン原子及びフェニル基からなる群より 選ばれた基が1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

イミダゾリジニル基(イミダゾリジン環上には、オキソ基、フェニルC1~6 アルキル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子及びC1~6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい] 及びフェニル基からなる群 より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) としては、例えば、イミダゾリジンー1ーイル基、イミダゾリジンー2ーイル基、イミダゾリジンー3ーイル基、イミダゾリジンー4ーイル基、イミダゾリジンー5ーイル基、3ーベンジルーイミダゾリジンー1ーイル基、3、4ージベンジルー2ーオキソイミダゾリジンー1ーイル基、3、4ージベンジルー2ーオキソイミダゾリジンー1ーイル基、3・ベンジル

-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-(2-フルオロベンジル)-2 - オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-(3-フルオロベンジル)-2-オ キソイミダゾリジン-1-イル基、3-(4-フルオロベンジル)-2-オキソ イミダゾリジン-1-イル基、3-フェニル-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-(3,4-ジフルオロベンジル)-2-オキソイミダゾリジン-1 -- イル基、3-(3,5-ジフルオロベンジル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-(3,4,5-トリフルオロベンジル)-2-オキソイミダゾ リジン-1-イル基、3-(2-クロロベンジル)-2-オキソイミダゾリジン -1-イル基、3-(3-クロロベンジル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-(4-クロロベンジル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、 3-(2,3-ジクロロベンジル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、 3-(3,4-ジクロロベンジル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、 3-(3,5-ジクロロベンジル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、 3-(3, 4, 5-トリクロロベンジル) -2-オキソイミダゾリジン-1-イ 15 ル基、3-(2-ブロモベンジル)-2-オキソイミダブリジン-1-イル基、 3- (3-ブロモベンジル) -2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-(4-ブロモベンジル) -2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-(2-メトキシベンジル) -2-オキソイミダブリジン-1-イル基、3-(3-メト キシベンジル) -2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-(4-メトキシ ベンジル) -2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-(2,4-ジメトキ シベンジル) -2-オキソイミダブリジン-1-イル基、3-(2,4,6-ト リメトキシベンジル) -2-オキソイミダブリジン-1-イル基、3-(3,5 ージメトキシベンジル) -2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-(4-エトキシベンジル) -2-オキソイミダブリジン-1-イル基、3-(4-イソ プロポキシベンジル) -2-オキソイミダブリジン-1-イル基、3-(4-n 25ーブトキシベンジル) -2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-(4-n ーペンチルオキシベンジル) -2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-(4-ヘキシルオキシベンジル) -2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3 - [2-(3-メトキシー4-クロロフェニル) エチル] -2-オキソイミダゾ リジン-1-イル基、3-[3-(4-クロロフェニル)プロピル]-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-[4-(4-クロロフェニル)プチル]-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-[5-(4-クロロフェニル)ペンチル]-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-[6-(4-クロロフェニル)ペンチル]-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-[6-(4-クロロフェニル)へキシル]-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、2-フェニルイミダゾリジン-1-イル基、3-フェニル-2-ボンジルイミダゾリジン-1-イル基、3-フェニル-4-ベンジル-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-フェニル-5-ベンジル-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、4-フェニル-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基(イミグゾリジン環上には、オキソ基、フェニルC1~6アルキル基[フェニル環上には、ハロゲン原子及びC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい]及びフェニル基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい。)を挙げることができる。

ベンゾイミダゾリジニル基(ベンゾイミダゾリジン環上には、オキソ基、ハロ 15 ゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、置換基としてC -1~6アルキル基を有することのあるアミノ基、C1~6アルコキシカルボニル 基及びピペリジル基[ピペリジン環上には、C1~6アルキル基、フェニル環上 にハロゲン原子が1~3個置換していてもよいフェニル基、C1~6アルコキシ カルボニル基及びフェニルC1~6アルコキシカルボニル基からなる群より選ば れた基の少なくとも1種が置換していてもよい]からなる群より選ばれた基を少 20 なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、ベンゾイミダゾリジン -1-イル基、ベンゾイミダゾリジン-2-イル基、ベンゾイミダゾリジン-3 ーイル基、ベンゾイミダゾリジン-4-イル基、ベンゾイミダゾリジン-5-イ ル基、ベンゾイミダゾリジンー6ーイル基、ベンゾイミダゾリジンー7ーイル基、 2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-メチル-2-オキソベンゾ 25 イミダゾリジンー1ーイル基、3ーメチルーベンゾイミダゾリジンー1ーイル基、 6-ジメチルアミノベンゾイミダゾリジン-1-イル基、6-エトキシカルボニ ルベンゾイミダゾリジンー1ーイル基、3ー(4ーフェニルピペリジンー4ーイ ル) ベンゾイミダゾリジンー1ーイル基、4ーフルオローベンゾイミダゾリジン

-1-イル基、3-エチル-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3 -n-プロピルー2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-n-ブチ ルー2-オキソベンゾイミダゾリジンー1-イル基、3-n-ペンチルー2-オ キソベンゾイミダゾリジンー1-イル基、3-n-ヘキシルー2-オキソベンゾ イミダゾリジン-1-イル基、3-メチル-6-フルオロ-2-オキソベンゾイ ミダゾリジン-1-イル基、3-メチル-4-フルオロ-2-オキソベンゾイミ ダゾリジン-1-イル基、3-メチル-5-フルオロ-2-オキソベンゾイミダ ゾリジン-1-イル基、3-メチル-7-フルオロ-2-オキソベンゾイミダゾ リジン-1-イル基、3-メチル-6-クロロ-2-オキソベンゾイミダゾリジ ンー1-イル基、3ーメチルー5-クロロー2-オキソベンゾイミダゾリジンー 10 1-イル基、3-メチル-4-クロロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3ーメチルー5ークロロー2ーオキソベンゾイミダゾリジンー1ーイル 基、3-メチル-7-クロロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、 3-メチル-6-ブロモー2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-15 メチルー4ーブロモー2ーオキソベンゾズイミダゾリジンー1ーイル基、3ーメ チル-5-ブロモ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-メチル - 7-ブロモー2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-エチルー6 -フルオロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-イソプロピル -6-フルオロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-n-ヘキ シルー6-フルオロー2-オキソゾンズイミダゾリジン-1-イル基、3-エチ 20 ルー6-クロロー2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-イソプロ ピルー6ークロロー2ーオキソベンゾイミダブリジンー1ーイル基、3ーnーへ キシルー6-クロロー2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-エチ ルー5ークロロー2ーオキソベンゾイミダゾリジンー1ーイル基、3ーイソプロ ピルー5ークロロー2ーオキソベンゾイミダゾリジンー1ーイル基、3ーter 25 tーブチルー5ークロロー2ーオキソベンゾイミダゾリジンー1ーイル基、3ー メチルー6-エトキシカルボニルー2-オキソベンゾイミダゾリジンー1-イル 基、3-イソプロピルー6-エトキシカルボニルー2-オキソベンゾイミダゾリ ジン-1-イル基、3-n-プロピル-6-エトキシカルボニル-2-オキソベ

ンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-メチル-6-トリフルオロメチル-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、5-トリフルオロメチル-2-オキ ソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-メチル-5-トリフルオロメチルー 2-オキソベンゾイミダゾリジン1-イル基、3-イソプロピル-5-トリフル オロメチルー2-オキソベンゾイミダゾリジン1-イル基、3-(4-フェニル ピペリジン-1-イル)-2-オキソベンゾイミダゾリジン1-イル基、3-(4-フェニルピペリジン-1-イル) -5-トリフルオロメチル-2-オキソ ベンゾイミダゾリジン1-イル基、3-(4-フェニルピペリジン-1-イル) - 6 - トリフルオロメチル- 2 - オキソベンゾイミダゾリジン1 - イル基、3 -メチルー6-ジメチルアミノー2-オキソベンゾイミダゾリジン1-イル基、3 10 - エチル-6-ジメチルアミノ-2-オキソベンゾイミダゾリジン1-イル基、 3-メチル-6-アミノ-2-オキソベンゾイミダゾリジン1-イル基、3-イ ソプロピルー6-ジメチルアミノー2-オキソベンゾイミダゾリジン1-イル基、 3-[4-(3-フルオロフェニル)ピペリジン-1-イル]-2-オキソベン ゾイミダゾリジン1ーイル基、3ー [4-(4-フルオロフェニル) ピペリジン 15 -1-イル] -2-オキソベンゾイミダブリジン1-イル基、3-[4-(3-クロロフェニル) ピペリジンー1ーイル] -2-オキソベンゾイミダゾリジン1 ーイル基、3-[4-(4-クロロフェニル) ピペリジン-1-イル]-2-オ キソベンゾイミダゾリジン1-イル基、3-[4-(2,3-ジフルオロフェニ ル) ピペリジン-1-イル] -5-クロロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン1 20 ーイル基、3-[4-(4-フルオロフェニル)ピペリジン-1-イル]-5-クロロー2ーオキソベンゾイミダゾリジン1ーイル基、3ー[4-(2,4,6 ートリクロロフェニル) ピペリジン-1-イル] -5-クロロ-2-オキソベン ゾイミダゾリジン1ーイル基、3ー[4-(4-クロロフェニル)ピペリジンー 1-イル] -5-クロロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン1-イル基、3-25 [4-(3-フルオロフェニル) ピペリジン-1-イル] -6-クロロ-2-オ キソベンゾイミダゾリジン1-イル基、3-[4-(4-ヨードフェニル)ピペ リジン-1-イル]-6-クロロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン1-イル基、 3-[4-(3-プロモフェニル) ピペリジン<math>-1-イル] -6-クロロ-2-

オキソベンゾイミダゾリジン1ーイル基、3-[1-メチルピペリジン-4-イ ル] -6-クロロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン1-イル基、3-(ピペリ ジン-4-イル)-2-オキソベンゾイミダゾリジン1-イル基、3-(1-t ertーブトキシカルボニルピペリジン-4-イル)-2-オキソベンゾイミダ ゾリジン1-イル基、3-(ベンジルオキシカルボニルピペリジン-4-イル) 5 - 2 - オキソベンゾイミダゾリジン1 - イル基、3 - (ピペリジン-4-イル) -6-フルオロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン1-イル基、3-(1tertーブトキシカルボニルピペリジン-4-イル) -6-フルオロー2-オ キソベンゾイミダゾリジン1-イル基、3-(1-ベンジルオキシカルボニルピ 10 ペリジンー4ーイル) -6-フルオロー2-オキソベンゾイミダブリジン1-イ ル基、3-(ピペリジン-4-イル)-6-クロロ-2-オキソベンゾイミダゾ リジン1-イル基、3-(1-tert-ブトキシカルボニルピペリジン-4-イル) -6-クロロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン1-イル基、3-(1-ベンジルオキシカルボニルー4ーピペリジニル) -6-クロロー2-オキソベン ゾイミダゾリジン1-イル基、3-(1,2-ジメチルピペリジン-4-イル) 15 ベンゾイミダゾリジン1-イル基、3-(1-ベンジルオキシカルボニルー2-メチルピペリジン-4-イル)ベンゾイミダゾリジン1-イル基、3-(1,2, 6-トリメチルピペリジン-4-イル) ベンゾイミダゾリジン1-イル基等のベ ンズイミダゾリジニル基(ベンゾイミダゾリジン環上には、オキソ基、ハロゲン 原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、置換基としてC1~ 6アルキル基を1~2個有することのあるアミノ基、C1~6アルコキシカルボ ニル基及びピペリジル基 [ピペリジン環上には、C1~6アルキル基、フェニル 環上にハロゲン原子が1~3個置換していてもよいフェニル基、C1~6アルコ キシカルボニル基及びフェニルC1~6アルコキシカルボニル基からなる群より 選ばれた基が1~3個置換していてもよい]からなる群より選ばれた基が1~3 25 個置換していてもよい。)を挙げることができる。

フタルイミド基としては、例えば、フタルイミド-2-イル基等が挙げられる。 インドリニル基(インドリン環上には、C1~6アルキル基、ハロゲン原子及 びオキソ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)

としては、例えば、インドリニンー1ーイル基、インドリニンー2ーイル基、イ ンドリニン-3-イル基、インドリニン-4-イル基、インドリニン-5-イル 基、インドリニンー6-イル基、インドリニン-7-イル基、3-メチルーイン ドリン-1-イル基、3,8-ジブロモインドリン-1-イル基、2-オキソイ ンドリンー1ーイル基(別名:オキシインドールー1ーイル基)、3ーメチルー 5 2-オキソインドリン-1-イル基、3,3-ジメチル-2-オキソインドリン -1-イル基、3-エチル-2-オキソインドリン-1-イル基、3-n-プロ ピルー2-オキソインドリン-1-イル基、3-n-ブチル-2-オキソインド リン-1-イル基、3-n-ペンチル-2-オキソインドリン-1-イル基、3 - フルオロ-2-オキソインドリン-1-イル基、3,3-ジフルオロ-2-オ 10 キソインドリン-1-イル基、3-クロロ-2-オキソインドリン-1-イル基、 3, 3-ジクロロ-2-オキソインドリン-1-イル基、等のインドリニル基 (インドリン環上には、C1~6アルキル基、ハロゲン原子及びオキソ基からな る群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

15 2, 3 - ジヒドロベンゾイソチアゾリル基(2, 3 - ジヒドロベンゾイソチアゾール環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい)としては、例えば、3 - ベンゾイソチアゾリジノン-1,1-ジオキサイド-2-イル基等を挙げることができる。

1H-2, 4-ベンゾオキサジニル基(1H-2, 4-ベンゾオキサジン環上 20 には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい)としては、1H-2, 4-ベンゾオキサジン-3(4H)-オン-4-イル基及び1H-2, 4-ベン ゾオキサジン-1,3(4H)-ジオン-4-イル基等を挙げることができる。

フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニノキシC 1~6アルキル基としては、例えば、フェノキシメチル基、2-フルオロフェノ 25 キシメチル基、3-フルオロフェノキシメチル基、3,4ージフルオロフェノキ シメチル基、3,5ージフルオロフェノキシメチル基、2,3,4,5,6ーペ ンタフルオロフェノキシメチル基、2-クロロフェノキシメチル基、3-クロロ フェノキシメチル基、4-クロロフェノキシメチル基、3,4ージクロロフェノ キシメチル基、3,5ージクロロフェノキシメチル基、2-フェノキシエチル基、

1-フェノキシエチル基、3-フェノキシプロピル基、4-フェノキシブチル基、 5-フェノキシペンチル基、6-フェノキシヘキシル基、2-(2,4,6-ク ロロフェノキシ)エチル基、3-(4-ヨードフェノキシ)プロピル基、4-(4-ブロモフェノキシ) ブチル基、5-(4-クロロフェノキシ) ペンチル基、 6-(4-クロロフェノキシ)へキシル基等のフェニル環上にハロゲン原子が1 5 ~5個置換していてもよいフェノキシC1~6アルキル基を挙げることができる。 フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニルC2~ 6アルケニル基としては、例えば、3-フェニル-2-プロペニル基(慣用名: シンナミル基)、4-フェニル-2-ブテニル基、4-フェニル-3-ブテニル 基、4-フェニル-1、3-ブタジエニル基、5-フェニル-1、3、5-ヘキ 10 サトリエニル基、3-(2-フルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(3 ーフルオロフェニル) -2-プロペニル基、3-(4-フルオロフェニル) -2 ープロペニル基、3-(2,3-ジフルオロフェニル)-2-プロペニル基、3 - (2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル) - 2 - プロペニル基、3-(3, 4-ジフルオロフェニル) -2-プロペニル基、3-(3, 5-ジフルオ 15 ロフェニル) -2-プロペニル基、3-(2,4,6-トリクロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(3-クロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(4 ークロロフェニル) -2-プロペニル基、3-(2,3-ジクロロフェニル) -2-プロペニル基、3-(2,4-ジクロロフェニル)-2-プロペニル基、3 - (3, 4-ジクロロフェニル) - 2 - プロペニル基、3 - (3, 5 - ジクロロ フェニル) -2-プロペニル基、3-(2-ブロモフェニル) -2-プロペニル 基、3-(3-ブロモフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-ブロモフェニ ル) -2-プロペニル基、4-(4-クロロフェニル) -2-ブテニル基、4-(4-クロロフェニル)-3-ブテニル基、5-(4-クロロフェニル)-2-・25 ペンテニル基、5-(4-クロロフェニル)-4-ペンテニル基、5-(4-ク ロロフェニル) -3-ペンテニル基、6-(4-クロロフェニル) -5-ヘキセ ニル基、6-(4-クロロフェニル)-4-ヘキセニル基、6-(4-クロロフ エニル) -3-ヘキセニル基、6-(4-クロロフェニル) -3-ヘキセニル基

等のフェニル環上にハロゲン原子を1~5個有することがあり、二重結合を1~

2個有するフェニルC2~6アルケニル基を挙げることができる。

フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1 ~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基及びフェ ニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよいフェニ 5 ル基としては、例えば、フェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフ エニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニ ル基、4ークロロフェニル基、2ーブロモフェニル基、3ーブロモフェニル基、 4ーブロモフェニル基、2-ヨードフェニル基、3-ヨードフェニル基、4-ヨ ードフェニル基、2,3-ジフルオロフェニル基、3,4-ジフルオロフェニル 基、3,5-ジフルオロフェニル基、2,4-ジフルオロフェニル基、2,6-10 ジフルオロフェニル基、2,3ージクロロフェニル基、3,4ージクロロフェニ ル基、3,5-ジクロロフェニル基、2,4-ジクロロフェニル基、2,6-ジ クロロフェニル基、3, 4, 5ートリフルオロフェニル基、3, 4, 5ートリク ロロフェニル基、2,4,6ートリフルオロフェニル基、2,4,6ートリクロ ロフェニル基、2-フルオロー4-ブロモフェニル基、4-クロロー3-フルオ 15 ロフェニル基、2,3,4ートリクロロフェニル基、3,4,5ートリフルオロ フェニル基、2,4,6―トリブロモフェニル基、4-n-ブチルフェニル基、 2, 4-ジメチルフェニル基、2, 3-ジメチルフェニル基、2, 6-ジメチル フェニル基、3,5-ジメチルフェニル基、2,5-ジメチルフェニル基、2, 4、6-トリメチルフェニル基、3、5-ジトリフルオロメチルフェニル基、4 20 -n-ブトキシフェニル基、2,4-ジメトキシフェニル基、2,3-ジメトキ シフェニル基、2,6-ジメトキシフェニル基、3,5-ジメトキシフェニル基、 2. 5ージメトキシフェニル基、2, 4, 6ートリメトキシフェニル基、3, 5 ージトリフルオロメトキシフェニル基、3-クロロー4-メトキシフェニル基、 2-クロロー4-トリフルオロメトキシフェニル基、3-メチルー4-フルオロ 25フェニル基、4ーブロモー3ートリフルオロメチルフェニル基、2ーメチルフェ ニル基、3-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-メチル-3-クロ ロフェニル基、3-メチルー4-クロロフェニル基、2-クロロー4-メチルフ

エニル基、2-メチルー3-フルオロフェニル基、2-トリフルオロメチルフェ

ニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル 基、2-ペンタフルオロエチルフェニル基、3-ペンタフルオロエチルフェニル 基、4-ペンタフルオロエチルフェニル基、2-イソプロピルフェニル基、3-イソプロピルフェニル基、4ーイソプロピルフェニル基、2-tert-ブチル フェニル基、3-tert-ブチルフェニル基、4-tert-ブチルフェニル 基、2-sec-ブチルフェニル基、3-sec-ブチルフェニル基、4sec-ブチルフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、3nーヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロピルフェ ニル基、4ーペンチルフェニル基、4ーヘキシルフェニル基、2ーメトキシフェ 10 ニル基、3-メトキシフェニル基、4-メトキシフェニル基、3-クロロ-2-メトキシフェニル基、2-フルオロ-3-メトキシフェニル基、2-フルオロー 4-メトキシフェニル基、2,6-ジメトキシフェニル基、2,3,4-トリフ ルオロフェニル基、2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニル基、2-トリ フルオロメトキシフェニル基、3-トリフルオロメトキシフェニル基、4-トリ フルオロメトキシフェニル基、3-フルオロ-2-トリフルオロメトキシフェニ 15 ル基、2-フルオロー3-トリフルオロメトキシフェニル基、3-フルオロー4 ートリフルオロメトキシフェニル基、3-クロロ-2-トリフルオロメトキシフ エニル基、2-クロロー3-トリフルオロメトキシフェニル基、3-クロロー4 ートリフルオロメトキシフェニル基、2ーペンタフルオロエトキシフェニル基、 3-ペンタフルオロエトキシフェニル基、4-ペンタフルオロエトキシフェニル 20 基、3-クロロ-2-ペンタフルオロエトキシフェニル基、2-クロロ-3-ペ ンタフルオロエトキシフェニル基、3-クロロー4-ペンタフルオロエトキシフ ェニル基、2-イソプロポキシフェニル基、3-イソプロポキシフェニル基、4 --イソプロポキシフェニル基、2-tert-ブトキシフェニル基、3-

25 tert-ブトキシフェニル基、4-tert-ブトキシフェニル基、2-sec-ブトキシフェニル基、3-sec-ブトキシフェニル基、4-sec-ブトキシフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-n-ヘキシルオキシフェニル基、4-n-ヘキシルオキシフェニル基、

4-ビフェニリル基、3-ビフェニリル基、2-ビフェニリル基等のフェニル環上にハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基及びフェニル基からなる群より選ばれた基が $1\sim5$ 個、好ましくは $1\sim3$ 個置換していてもよいフェニル基を挙げることができる。

1,3-チアゾリジニル基(1,3-チアゾリジン環上には、置換基としてオ キソ基及びフェニル環上にハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基を有し ていてもよいフェニルC1~6アルキリデン基からなる群より選ばれる基の少な くとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、1,3-チアゾリジン-2ーイル基、1、3ーチアゾリジンー3ーイル基、1、3ーチアゾリジンー4ー 10 イル基、1,3ーチアゾリジン-5ーイル基、1,3ーチアゾリジン-2,4-ジオンー3ーイル基、5ーベンジリデンー1,3ーチアゾリジンー3ーイル基、 5-ベンジリデンー1,3-チアゾリジンー2,オンー3-イル基、5-ベンジ リデンー1,3-チアゾリジンー4-オン-3-イル基、5-(2-メチルベン ジリデン)-1,3ーチアゾリジン-3-イル基、5-(2,4-ジメチルベン 15 ジリデン)-1,3ーチアゾリジン-3ーイル基、5-(2,4,6-トリメチ ν ベンジリデン) -1, 3-チアゾリジン-3-イル基、5-ベンジリデン-1, 3-チアゾリジン-2, 4-ジオン-3-イル基、5-(2-トリフルオロメチ ルベンジリデン) -1, 3-チアゾリジン-2, 4-ジオン-3-イル基、5-20 (3,5-ジトリフルオロメチルベンジリデン)-1,3-チアゾリジン-2, 4-ジオン-3-イル基、5-(4-トリフルオロメチルベンジリデン)-1. 3ーチアゾリジンー2、4ージオンー3ーイル基、5ー[2ー(4ートリフルオ ロメチルフェニル) エチリデン] -1, 3-チアゾリジン-2, 4-ジオン-3 ーイル基、5- [3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロピリデン]-1, 3-チアゾリジン-2, 4-ジオン-3-イル基、5-[4-(4-トリフルオ 25 ロメチルフェニル)ブチリデン]-1,3-チアゾリジン-2,4-ジオン-3 ーイル基、5- [5-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチリデン] -1, 3-4 ディーション 3-4 ル 基、5-[6-(4-1)] フルオ

ロメチルフェニル) ヘキシリデン] -1, 3-チアゾリジン-2, 4-ジオン-

3-4ル基等の1、3-4アゾリジニル基(1、3-4アゾリジン環上には、置換基としてオキソ基及びフェニル環上にハロゲン置換又は未置換の $C1\sim6$ アルキル基を $1\sim3$ 個有していてもよいフェニル $C1\sim6$ アルキルデン基からなる群より選ばれる基が $1\sim3$ 個置換していてもよい)を挙げることができる。

- ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基としては、例えば、フェニル基、2 -フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2 ークロロフェニル基、3ークロロフェニル基、4ークロロフェニル基、2ーブロ モフェニル基、3ーブロモフェニル基、4ーブロモフェニル基、2ーヨードフェ ニル基、3-ヨードフェニル基、4-ヨードフェニル基、2、3-ジフルオロフ エニル基、3、4ージフルオロフェニル基、3、5ージフルオロフェニル基、2、 10 4-ジフルオロフェニル基、2、6-ジフルオロフェニル基、2、3-ジクロロ フェニル基、3,4-ジクロロフェニル基、3,5-ジクロロフェニル基、2, 4-ジクロロフェニル基、2,6-ジクロロフェニル基、3,4,5-トリフル オロフェニル基、3、4、5ートリクロロフェニル基、2、4、6ートリフルオ ロフェニル基、2,4,6ートリクロロフェニル基、2ーフルオロー4ーブロモ 15 フェニル基、4-クロロー3-フルオロフェニル基、2,3,4-トリクロロフ エニル基、3,4,5ートリフルオロフェニル基、2,4,6ートリフルオロフ ェニル基、2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニル基等のフェニル環上に
- フェニル環上に置換基としてフェニル基を有することのあるフェニルC1~6
 アルキル基としては、例えば、ベンジル基、2-フェニルエチル基、1-フェニルエチル基、3-フェニルプロピル基、4-フェニルブチル基、5-フェニルペンチル基、6-フェニルへキシル基、2-メチル-3-フェニルプロピル基、1,1-ジメチル-2-フェニルエチル基、3-フェニルベンジル基、2-フェニル ペンジル基、4-フェニルベンジル基、2,4,6-トリフェニルベンジル基等のフェニル環上に置換基としてフェニル基を1~3個有することのあるフェニルC1~6アルキル基を挙げることができる。

ハロゲン原子が1~5個置換していてもよいフェニル基を挙げることができる。

フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基、

アミノ基「アミノ基上には、C1~6アルキル基及びフェニル基(フェニル環上 には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロ ゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少 なくとも1種が置換していてもよい)からなる群より選ばれた基の少なくとも1 種が置換していてもよい〕、フェノキシ基「フェニル環上には、ハロゲン原子、 ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置 換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換し ていてもよい〕及びピペリジル基「ピペリジン環上には、少なくとも1個のフェ ノキシ基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1 ~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からな 10 る群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)が置換していても よい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)とし ては、例えば、フェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、 4ーフルオロフェニル基、2ークロロフェニル基、3ークロロフェニル基、4ー クロロフェニル基、2-ブロモフェニル基、3-ブロモフェニル基、4-ブロモ 15 フェニル基、2-ヨードフェニル基、3-ヨードフェニル基、4-ヨードフェニ ル基、2,3-ジフルオロフェニル基、2,3,4,5,6-ペンタフルオロフ ェニル基、3,4-ジフルオロフェニル基、3,5-ジフルオロフェニル基、2, 4-ジフルオロフェニル基、2,6-ジフルオロフェニル基、2,3-ジクロロ フェニル基、3,4-ジクロロフェニル基、3,5-ジクロロフェニル基、2, 20 4-ジクロロフェニル基、2,6-ジクロロフェニル基、3,4,5-トリフル オロフェニル基、3、4、5ートリクロロフェニル基、2、4、6ートリフルオ ロフェニル基、2、4、6ートリクロロフェニル基、2ーメチルフェニル基、3 ーメチルフェニル基、4ーメチルフェニル基、2,4ージメチルフェニル基、2, 4,6-トリメチルフェニル基、2-メチル-3-クロロフェニル基、3-メチ 25 ルー4-クロロフェニル基、2-クロロー4-メチルフェニル基、2-メチルー 3-フルオロフェニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、3-トリフルオ ロメチルフェニル基、3,5-ジトリフルオロメチルフェニル基、4-トリフル オロメチルフェニル基、2ーペンタフルオロエチルフェニル基、3ーペンタフル

オロエチルフェニル基、4ーペンタフルオロエチルフェニル基、2ーイソプロピ ルフェニル基、3-イソプロピルフェニル基、4-イソプロピルフェニル基、2 -tertーブチルフェニル基、3-tertーブチルフェニル基、4tertーブチルフェニル基、2-sec-ブチルフェニル基、3-sec-ブ チルフェニル基、4-sec-ブチルフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロ ピルフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-n-ヘプタ フルオロプロピルフェニル基、4ーペンチルフェニル基、4ーヘキシルフェニル 基、2-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、4-メトキシフェニル 基、2-メトキシ-3-クロロフェニル基、2-フルオロ-3-メトキシフェニ ル基、2-フルオロー4-メトキシフェニル基、2,6-ジメトキシフェニル基、 10 2. 4. 6-トリメトキシフェニル基、2-トリフルオロメトキシフェニル基、 3-トリフルオロメトキシフェニル基、3,5-ジトリフルオロメトキシフェニ ル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基、2-ペンタフルオロエトキシフェ ニル基、3ーペンタフルオロエトキシフェニル基、4ーペンタフルオロエトキシ フェニル基、2ーイソプロポキシフェニル基、3ーイソプロポキシフェニル基、 15 4-イソプロポキシフェニル基、2-tert-ブトキシフェニル基、3tertーブトキシフェニル基、4-tert-ブトキシフェニル基、2secーブトキシフェニル基、3-secーブトキシフェニル基、4-sec-ブトキシフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、3-n-20 ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェ ニル基、4-ペンチルオキシフェニル基、4-ヘキシルオキシフェニル基、2-アミノフェニル基、3-アミノフェニル基、4-アミノフェニル基、3-メチル アミノフェニル基、3-ジメチルアミノフェニル基、4-メチルアミノフェニル 基、4-ジメチルアミノフェニル基、4-エチルアミノフェニル基、4-ジエチ ルアミノフェニル基、4-n-プロピルアミノフェニル基、4-ジ-n-プロピ 25 ルアミノフェニル基、4-n-ブチルアミノフェニル基、4-ジ-n-ブチルア ミノフェニル基、4-n-ペンチルアミノフェニル基、4-ジ-n-ペンチルア ミノフェニル基、4-n-ヘキシルアミノフェニル基、4-ジ-n-ヘキシルア ミノフェニル基、4ーフェニルアミノフェニル基、4-(2-フルオロフェニル

アミノ)フェニル基、4-(3-フルオロフェニルアミノ)フェニル基、4-(4-フルオロフェニルアミノ) フェニル基、4-(2,3,4,5,6-ペン タフルオロフェニルアミノ)フェニル基、4-(2,4-ジフルオロフェニルア ミノ)フェニル基、4-(3,4-ジフルオロフェニルアミノ)フェニル基、4 5 - (3, 5-ジフルオロフェニルアミノ) フェニル基、4-(2-クロロフェニ ルアミノ)フェニル基、4-(3-クロロフェニルアミノ)フェニル基、4-(4-クロロフェニルアミノ)フェニル基、4-(2-ブロモフェニルアミノ) フェニル基、4-(3-ブロモフェニルアミノ)フェニル基、4-(4-ブロモ フェニルアミノ)フェニル基、4-(2,3-ジクロロフェニルアミノ)フェニ ル基、4-(2,4-ジクロロフェニルアミノ)フェニル基、4-(2,4,6 10 ートリクロロフェニルアミノ)フェニル基、4-(3,5-ジクロロフェニルア ミノ)フェニル基、4-(2-メチルフェニルアミノ)フェニル基、4-(3-メチルフェニルアミノ)フェニル基、4-(4-メチルフェニルアミノ)フェニ ル基、4-(2-エチルフェニルアミノ)フェニル基、4-(3-エチルフェニ ルアミノ)フェニル基、4-(4-エチルフェニルアミノ)フェニル基、4-15 (4-n-プロピルフェニルアミノ) フェニル基、4-(4-tert-ブチル フェニルアミノ)フェニル基、4-(4-n-ブチルフェニルアミノ)フェニル 基、4-(2-トリフルオロメチルフェニルアミノ)フェニル基、4-(3-ト リフルオロメチルフェニルアミノ)フェニル基、4-(4-トリフルオロメチル フェニルアミノ)フェニル基、4-(2-ペンタフルオロエチルフェニルアミ 20 ノ)フェニル基、4-(3-ペンタフルオロエチルフェニルアミノ)フェニル基、 4-(2,3-ジメチルフェニルアミノ)フェニル基、4-(3,4,5-トリ メチルフェニルアミノ)フェニル基、4-(4-ペンチルフェニルアミノ)フェ ニル基、4-(4-ヘキシルフェニルアミノ)フェニル基、4-(2-トリフル 25オロメトキシフェニルアミノ)フェニル基、4-(3-トリフルオロメトキシフ ェニルアミノ)フェニル基、4-(3-メトキシフェニルアミノ)フェニル基、 4-(2, 4-ジメトキシフェニルアミノ)フェニル基、4-(2, 4, 6-ト リメトキシフェニルアミノ)フェニル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェ ニルアミノ)フェニル基、4-(2-ペンタフルオロエトキシフェニルアミノ)

フェニル基、4-(3-ペンタフルオロエトキシフェニルアミノ)フェニル基、 4-(4-ペンタフルオロエトキシフェニルアミノ)フェニル基、3-(N-メ チルーN-フェニルアミノ)フェニル基、2-フェノキシフェニル基、3-フェ ノキシフェニル基、4-フェノキシフェニル基、2-(2-クロロフェノキシ) フェニル基、2、4ージフェノキシフェニル基、2ー(3ークロロフェノキシ) フェニル基、2-(4-クロロフェノキシ)フェニル基、3-(2-クロロフェ ノキシ)フェニル基、3-(3-クロロフェノキシ)フェニル基、3-(4-ク ロロフェノキシ)フェニル基、4-(2-クロロフェノキシ)フェニル基、4-(2、3-ジクロロフェノキシ)フェニル基、4-(2,4,6-トリクロロフ ェノキシ)フェニル基、2- (2-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、 10 2- (3-トリフルオロメチルフェノキシ) フェニル基、2- (4-トリフルオ ロメチルフェノキシ)フェニル基、3-(2-トリフルオロメチルフェノキシ) フェニル基、3-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、3-(2, 3, 4, 5, 6ーペンタフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、4ー(2ート リフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、4-(3-メチルフェノキシ)フェ 15 ニル基、4-(2,4-ジメチルフェノキシ)フェニル基、4-(2,4,6-トリメチルフェノキシ)フェニル基、4-(3-トリフルオロメチルフェノキ シ)フェニル基、4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、2-(2-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、2-(3-トリフルオロ メトキシフェノキシ)フェニル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェノキ 20 シ)フェニル基、2-(4-メトキシフェノキシ)フェニル基、2-(2,4-ジメトキシフェノキシ)フェニル基、2-(2,4,6-トリメトキシフェノキ シ)フェニル基、3-(2-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、3 - (3-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、3-(4-トリフルオ ロメトキシフェノキシ)フェニル基、4-(2-トリフルオロメトキシフェノキ 25シ)フェニル基、4-(3-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、4 - (4-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、2-(4-フェノキシ ピペリジン-1-イル)フェニル基、3-(4-フェノキシピペリジン-1-イ ル)フェニル基、4-(4-フェノキシピペリジン-1-イル)フェニル基、2

- [4-(4-クロロフェノキシ)ピペリジン-1-イル]フェニル基、4-[4-(4-クロロフェノキシ)ピペリジン-1-イル]フェニル基、3-[4 - (2, 4, 6-トリクロロフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェニル基、 4- [4-(3, 4-ジクロロフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェニル基、 4-[4-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェノキシ) ピペリジン<math>-1ーイル] フェニル基、4ー[4ー(4ーブロモフェノキシ)ピペリジンー1ーイ ル] フェニル基、3-[4-(4-クロロフェノキシピペリジン-1-イル) フ ェニル基、2-[4-(4-メチルフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェニ ル基、2-[4-(3,4-ジメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル]フェ ニル基、2-[4-(3,4,5-トリメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イ 10 ル】フェニル基、3-「4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジン -1-イル] フェニル基、4- [4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) ピ ペリジン-1-イル]フェニル基、3-[4-(4-ペンタフルオロエチルフェ ノキシ)ピペリジンー1ーイル]フェニル基、4- [4- (4-ペンタフルオロ エチルフェノキシ) ピペリジンー1ーイル] フェニル基、2ー [4ー(4ートリ 15 フルオロメトキシフェノキシピペリジン-1-イル)フェニル基、3-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェニル基、 4-「4-(4-メトキシフェノキシ)ピペリジン-1-イル]フェニル基、4 - [4-(2,4-ジメトキシフェノキシ)ピペリジン-1-イル]フェニル基、 4-[4-(2,4,6-トリメトキシフェノキシ)ピペリジン-1-イル]フ 20 エニル基、4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン-1 ーイル] フェニル基、2-[4-(4ーペンタフルオロエトキシフェノキシ)ピ ペリジン-1-イル]フェニル基、4-[4-(4-ペンタフルオロエトキシフ ェノキシ)ピペリジン-1-イル]フェニル基、(3,4-ジフェノキシピペリ ジン-1-イル)フェニル基、ピペリジン-1-イルフェニル基、(3,4,5 ートリフェノキシピペリジンー1ーイル)フェニル基、ピペリジンー4ーイルフ ェニル基等のフェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もし くは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アル コキシ基、アミノ基[アミノ基上には、C1~6アルキル基及びフェニル基(フ

ェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル 基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ば れた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい)からなる群より選 ばれた基が1~2個置換していてもよい)、フェノキシ基[フェニル環上には、 ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置 5 換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、 好ましくは1~3個置換していてもよい。]及びピペリジル基[ピペリジン環上 には、置換基としてフェノキシ基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン 置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1 ~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置 10 換していてもよい)が1~3個置換していてもよい]からなる群より選ばれた基 が1~5個、好ましくは1~3個置置換していてもよい)を挙げることができる。 ピペラジニルC1~6アルキル基(ピペラジン環上には、C1~6アルコキシ カルボニル基及びフェニルC1~6アルコキシカルボニル基 [フェニル環上には、 ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置 15 換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基及びフェニル基からなる群より選ばれ た基が1~3個置換していてもよい]からなる群より選ばれた基の少なくとも1 種が置換していてもよい)としては、例えば、1-ピペラジニルメチル基、2-(2-ピペラジニル) エチル基、1-(3-ピペラジニル) エチル基、3-(4 ーピペラジニル)プロピル基、4-(1-ピペラジニル)ブチル基、5-(2-20 ピペラジニル)ペンチル基、6-(3-ピペラジニル)へキシル基、4-メトキ シカルボニル-1-ピペラジニルメチル基、2-(4-メトキシカルボニル-1 - ピペラジニル) エチル基、3- (4-メトキシカルボニル-1-ピペラジニ ル)プロピル基、4-(4-メトキシカルボニル-1-ピペラジニル)ブチル基、 5- (4-メトキシカルボニル-1-ピペラジニル)ペンチル基、6-(4-メ 25トキシカルボニルー1ーピペラジニル) ヘキシル基、4ーエトキシカルボニルー 1-ピペラジニルメチル基、2-(4-エトキシカルボニル-1-ピペラジニ ル) エチル基、3-(4-エトキシカルボニル-1-ピペラジニル) プロピル基、 4- (4-エトキシカルボニル-1-ピペラジニル) ブチル基、5- (4-エト

キシカルボニル-1-ピペラジニル)ペンチル基、6-(4-エトキシカルボニ ルー1-ピペラジニル) ヘキシル基、4-tertーブトキシカルボニルー1-ピペラジニルメチル基、2-(4-tert-ブトキシカルボニル-1-ピペラ ジニル) エチル基、3- (4-tert-ブトキシカルボニル-1-ピペラジニ ル) プロピル基、4- (4-tert-ブトキシカルボニル-1-ピペラジニ ル) ブチル基、5-(4-tert-ブトキシカルボニル-1-ピペラジニル) ペンチル基、6-(4-tert-ブトキシカルボニル-1-ピペラジニル)へ キシル基、2-(4-ビフェニリルメトキシカルボニル-1-ピペラジニル)エ チル基、3-(4-ビフェニリルメトキシカルボニル-1-ピペラジニル)プロ ピル基、4-(4-ビフェニリルメトキシカルボニル-1-ピペラジニル)ブチ 10 ル基、5-(4-ビフェニリルメトキシカルボニル-1-ピペラジニル)ペンチ ル基、6-(4-ビフェニリルメトキシカルボニル-1-ピペラジニル)へキシ ル基、2-(4-ベンジルオキシカルボニル-1-ピペラジニル)エチル基、3 - (4-ベンジルオキシカルボニル-1-ピペラジニル)プロピル基、4-(4 ーベンジルオキシカルボニルー1-ピペラジニル)ブチル基、5ー(4ーベンジ 15 ルオキシカルボニル-1-ピペラジニル)ペンチル基、6-(4-ベンジルオキ シカルボニル-1-ピペラジニル) ヘキシル基、2-(4-(2-フルオロベン ジルオキシカルボニル) -1-ピペラジニル) エチル基、3-(4-(2-フル オロベンジルオキシカルボニル) -1-ピペラジニル) プロピル基、4-(4-(2, 3-ジフルオロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)ブチル 20 基、5-(4-(2-フルオロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニ ル)ペンチル基、6-(4-(4-フルオロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル) ヘキシル基、3-(4-(3-フルオロベンジルオキシカルボニ ル) -1-ピペラジニル) プロピル基、4-(4-(3-フルオロベンジルオキ シカルボニル) -1-ピペラジニル) ブチル基、5-(4-(3-フルオロベン 25ジルオキシカルボニル) -1-ピペラジニル) ペンチル基、3-(4-(4-フ ルオロベンジルオキシカルボニル) -1-ピペラジニル) プロピル基、4-(4 - (4-フルオロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)ブチル基、 5-(4-(4-フルオロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)ペ

ンチル基、6-(4-(4-フルオロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラ ジニル) ヘキシル基、2-(4-(2,3-ジクロロベンジルオキシカルボニ ル) -1-ピペラジニル) エチル基、3-(4-(2-クロロベンジルオキシカ ルボニル) -1-ピペラジニル) プロピル基、4-(4-(2-クロロベンジル オキシカルボニル) -1-ピペラジニル) ブチル基、5-(4-(2,4,6-トリクロロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)ペンチル基、6-(4-(2-クロロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)へキシル 基、2-(4-(3-クロロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル) エチル基、3-(4-(3-クロロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジ ニル)プロピル基、4ー(4-(3-クロロベンジルオキシカルボニル)-1-10 ピペラジニル) ブチル基、5-(4-(3-クロロベンジルオキシカルボニル) -1-ピペラジニル)ペンチル基、6-(3-クロロ-4-メチルベンジルオキ シカルボニル-1-ピペラジニル)へキシル基、2-(4-(4-クロロベンジ ルオキシカルボニル) -1-ピペラジニル) エチル基、3-(4-(4-クロロ ベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)プロピル基、4-(4-(4 15 ークロロー3ーメトキシベンジルオキシカルボニル)ー1ーピペラジニル)ブチ ル基、5-(4-(4-クロロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニ ル)ペンチル基、6-(4-クロロベンジルオキシカルボニル-1-ピペラジニ ル) ヘキシル基、2-(4-(2-メチルベンジルオキシカルボニル) -1-ピ ペラジニル) メチル基、2-(4-(2,4-ジメチルベンジルオキシカルボニ 20 ル) -1-ピペラジニル) メチル基、2-(4-(2,4,6-トリメチルベン ジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)メチル基、2-(4-(2-トリ フルオロメチルベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)エチル基、3 - (4-(3,5-ジトリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル)-1-ピ ペラジニル) プロピル基、4-(4-(2-トリフルオロメチルベンジルオキシ 25カルボニル) -1-ピペラジニル) ブチル基、5-(4-(2-トリフルオロメ チルベンジルオキシカルボニル) -1-ピペラジニル)ペンチル基、6-(4-(2-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル) -1-ピペラジニル) へ キシル基、3-(4-(3-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル)-

1-ピペラジニル)プロピル基、4-(4-(3-トリフルオロメチルベンジル オキシカルボニル) -1-ピペラジニル) ブチル基、5-(4-(3-トリフル オロメチルベンジルオキシカルボニル) -1-ピペラジニル) ペンチル基、3-(4-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル) -1-ピペラジニ ル)プロピル基、4-(4-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニ ル) -1-ピペラジニル) ブチル基、5-(4-(4-トリフルオロメチルベン ジルオキシカルボニル) -1-ピペラジニル) ペンチル基、6-(4-(4-ト リフルオロメチルベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)へキシル基、 2-(4-(3, 5-ジトリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル)-1 10 -ピペラジニル)エチル基、2-(4-(2-メトキシベンジルオキシカルボニ ル) -1-ピペラジニル) メチル基、2-(4-(2, 4-ジメトキシベンジル オキシカルボニル) -1-ピペラジニル) メチル基、2-(4-(2,4,6-トリメトキシベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)メチル基、3-(4-(2-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル) -1-ピペラジ 15 ニル)プロピル基、4-(4-(2-トリフルオロメトキシベンジルオキシカル ボニル) -1-ピペラジニル) ブチル基、5-(4-(2-トリフルオロメトキ シベンジルオキシカルボニル) -1-ピペラジニル) ペンチル基、6-(4-(2-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル) -1-ピペラジニル) ヘキシル基、3-(4-(3-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニ 20 ル) -1-ピペラジニル) プロピル基、4-(4-(3-トリフルオロメトキシ ベンジルオキシカルボニル) -1-ピペラジニル) ブチル基、5-(4-(3-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル) -1-ピペラジニル) ペンチ ル基、3-(4-(4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル)-1 -ピペラジニル)プロピル基、4-(4-(4-トリフルオロメトキシベンジル オキシカルボニル) -1-ピペラジニル) ブチル基、5-(4-(4-トリフル 25 オロメトキシベンジルオキシカルボニル) -1-ピペラジニル) ペンチル基、6 - (4-(4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル) -1-ピペラ ジニル) ヘキシル基、(3,4-ジエトキシカルボニル-1-ピペラジニル) メ チル基、4-フェニルメトキシカルボニル-2,5-ジメトキシカルボニル-1

ーピペラジニル)メチル基等のピペラジニルC1~6アルキル基(ピペラジン環上には、C1~6アルコキシカルボニル基及びフェニルC1~6アルコキシカルボニル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基及びフェニル基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい)が挙げられる。

ピペラジニルカルボニルC1~6アルキル基(ピペラジン環上には、C1~6 アルコキシカルボニル基、フェニル環上に置換基としてハロゲン置換もしくは未 置換のC1~6アルキル基を有していてもよいフェニルC1~6アルコキシカル ボニル基及びフェニルC1~6アルキル基 [フェニル環上には、ハロゲン置換も 10 しくは未置換のC1~6アルキル基及びフェニル基からなる群より選ばれた基の 少なくとも1種が置換していてもよい]からなる群より選ばれた基の少なくとも 1種が置換していてもよい)としては、例えば、1-ピペラジニルカルボニルメ・ チル基、2-(2-ピペラジニルカルボニル)エチル基、1-(3-ピペラジニ ルカルボニル) エチル基、3-(4-ピペラジニルカルボニル) プロピル基、4 - (1-ピペラジニルカルボニル)ブチル基、5-(2-ピペラジニルカルボニ ル)ペンチル基、6-(3-ピペラジニルカルボニル)へキシル基、4tertーブトキシカルボニルー1ーピペラジニルカルボニルメチル基、2ー (4-tert-ブトキシカルボニル-1-ピペラジニルカルボニル) エチル基、 3- (4-tert-ブトキシカルボニル-1-ピペラジニルカルボニル)プロ 20 ピル基、4-(4-tert-ブトキシカルボニル-1-ピペラジニルカルボニ ル)ブチル基、5-(メトキシカルボニル-1-ピペラジニルカルボニル)ペン チル基、6-(4-tert-ブトキシカルボニル-1-ピペラジニルカルボニ ル) ヘキシル基、4-エトキシカルボニル-1-ピペラジニルカルボニルメチル 基、2-(4-エトキシカルボニル-1-ピペラジニルカルボニル)エチル基、 3-(4-n-プロポキシカルボニル-1-ピペラジニルカルボニル)プロピル 基、4- (4-エトキシカルボニル-1-ピペラジニルカルボニル)ブチル基、 5-(4-n-ペンチルオキシカルボニル-1-ピペラジニルカルボニル)ペン

チル基、6-(4-n-ヘキシルオキシカルボニル-1-ピペラジニルカルボニ

ル)へキシル基、4-(ベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニルカルボ ニルメチル基、2-(4-(ベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニルカ ルボニル) エチル基、3-(4-(ベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジ ニルカルボニル)プロピル基、4-(4-(ベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニルカルボニル)ブチル基、5-(4-(ベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニルカルボニル)ペンチル基、6 - (4 - (ベンジルオキシカル ボニル) -1-ピペラジニルカルボニル) ヘキシル基、4-(4-メチルベンジ ルオキシカルボニル) -1-ピペラジニルカルボニルメチル基、4-(2,4-ジメチルベンジルオキシカルボニル) -1-ピペラジニルカルボニルメチル基、 4-(2, 4, 6-トリメチルベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル 10 カルボニルメチル基、4-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニ ル) -1-ピペラジニルカルボニルメチル基、2-(4-(3,5-ジトリフル オロメチルベンジルオキシカルボニル) -1-ピペラジニルカルボニル) エチル 基、3-(4-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル)-1-ピ ペラジニルカルボニル)プロピル基、4-(4-(4-トリフルオロメチルベン 15 ジルオキシカルボニル) -1-ピペラジニルカルボニル) ブチル基、5-(4-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル) -1-ピペラジニルカル ボニル)ペンチル基、6-(4-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシカル ボニル)-1-ピペラジニルカルボニル)へキシル基、4-(2-フェニルエト キシカルボニル) -1-ピペラジニルカルボニルメチル基、2-{4-[2-20 (4-トリフルオロメチルフェニル) エトキシカルボニル] -1-ピペラジニル カルボニル} エチル基、3-{4-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル) エトキシカルボニル] -1-ピペラジニルカルボニル} プロピル基、4-{4-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル) エトキシカルボニル] -1-ピペラ ジニルカルボニル} ブチル基、5-{4-[2-(2, 4, 6-トリメチルフェ ニル) エトキシカルボニル] -1-ピペラジニルカルボニル} ペンチル基、6-{4-「2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エトキシカルボニル]-1-ピペラジニルカルボニル トヘキシル基、4ーベンジルー1ーピペラジニルカルボ

ニルメチル基、4- (4-トリフルオロメチルベンジル) -1-ピペラジニルカ

ルボニルメチル基、2-(4-(4-トリフルオロメチルベンジル)-1-ピペ ラジニルカルボニル) エチル基、3-(4-(4-トリフルオロメチルベンジ ル) -1-ピペラジニルカルボニル) プロピル基、4-(4-メチルベンジル) -1-ピペラジニルカルボニルメチル基、4-(2,4-ジメチルベンジル)-1-ピペラジニルカルボニルメチル基、4-(2, 4, 6-トリメチルベンジ ル) -1-ピペラジニルカルボニルメチル基、4-(4-(4-トリフルオロメ チルベンジル) -1-ピペラジニルカルボニル) ブチル基、5-(4-(3,5 - ジトリフルオロメチルベンジル) - 1 - ピペラジニルカルボニル) ペンチル基、 6-(4-(4-トリフルオロメチルベンジル)-1-ピペラジニルカルボニ ル) ヘキシル基、4-(4-ビフェニリルメチル) -1-ピペラジニルカルボニ 10 ルメチル基、2-(4-(4-ビフェニリルメチル)-1-ピペラジニルカルボ ニル) エチル基、3-(4-(4-ビフェニリルメチル)-1-ピペラジニルカ ルボニル)プロピル基、4-(4-(4-ビフェニリルメチル)-1-ピペラジ ニルカルボニル)ブチル基、5-(4-(4-ビフェニリルメチル)-1-ピペ ラジニルカルボニル)ペンチル基、6-(4-(4-ビフェニリルメチル)-1 15 - ピペラジニルカルボニル) ヘキシル基、2, 4 - ジベンジルー1 - ピペラジニ ルカルボニルメチル基、4-ベンジルオキシカルボニル-3-ベンジル-1-ピ ペラジニルカルボニルメチル基、4-エトキシカルボニル-2,6-ジベンジル -1-ピペラジニルカルボニルメチル基等のピペラジニルカルボニルC1 \sim 6Tルキル基(ピペラジン環上には、C1~6アルコキシカルボニル基、フェニル環 20 上に置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基を1~3個 有していてもよいフェニルC1~6アルコキシカルボニル基並びにフェニル環上 に置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びフェニル 基からなる群より選ばれた基が1~3個有することのあるフェニルC1~6アル キル基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい)を挙げること 25 ができる。

フェニルカルバモイル $C1\sim6$ アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基が少なくとも1 個置換していてもよい)としては、例えば、4-メチルフェニルカルバモイルメチル基、2, 4-ジメチル

フェニルカルバモイルメチル基、2,4,6ートリメチルフェニルカルバモイルメチル基、3ーエチルフェニルカルバモイルメチル基、2-nープロピルフェニルカルバモイルメチル基、4-nープチルフェニルカルバモイルメチル基、4-nーペンチルフェニルカルバモイルメチル基、4-nーペンチルフェニルカルバモイルメチル基、4-nーペキシルフェニルカルバ5 モイルメチル基、4-トリフルオロメチルフェニルカルバモイルメチル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニルカルバモイル) エチル基、3-(3,5-ジトリフルオロメチルフェニルカルバモイル) プロピル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニルカルバモイル) ブチル基、5-(4-トリフルオロメチルフェニルカルバモイル) ペンチル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニルカルバモイル) ペンチル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニルカルバモイル) ペキシル基等のフェニル環上に置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基を1~3個有していてもよいフェニルカルバモイルC1~6アルキル基を挙げることができる。

ベンゾオキサゾリルC1~6アルキル基(ベンゾオキサゾール環上には、少な くとも1個のオキソ基が置換していてもよい。)としては、例えば、ベンゾオキ サゾールー2ーイルメチル基、ベンゾオキサゾールー4ーイルメチル基、ベンゾ 15 オキサゾールー5ーイルメチル基、ベンゾオキサゾールー6ーイルメチル基、ベ ンゾオキサゾール-7-イルメチル基、2- (ベンゾオキサゾール-2-イル) エチル基、1-(ベンゾオキサゾール-4-イル)エチル基、3-(ベンゾオキ サゾールー5ーイル)プロピル基、4ー (ベンゾオキサゾールー6ーイル)ブチ ル基、5-(ベンゾオキサゾール-7-イル)ペンチル基、6-(ベンゾオキサ 20 ゾールー2-イル)ヘキシル基、2-メチル-3-(ベンゾオキサゾール-4-イル)プロピル基、1,1-ジメチル-2-(ベンゾオキサゾール-5-イル) エチル基、(2,3-ジヒドロ-2-オキソーベンゾオキサゾール-3-イル) メチル基、 (2, 3-ジヒドロ-2-オキソーベンゾオキサゾールー4-イル) 25 メチル基、 (2, 3-ジヒドロ-2-オキソーベンゾオキサゾール-5-イル) メチル基、 (2,3-ジヒドロ-2-オキソーベンゾオキサゾールー6-イル) メチル基、(2,3-ジヒドロ-2-オキソーベンゾオキサゾール-7-イル) メチル基等を挙げることができる。

フェニルチオカルバモイル基(フェニル環上には、少なくとも1個のハロゲン

15

20

25

原子が置換していてもよい)としては、例えば、フェニルチオカルバモイル基、 4-フルオロフェニルチオカルバモイル基、4-クロロフェニルチオカルバモイル基、4-ブロモフェニルチオカルバモイル基、3,4-ジクロロフェニルチオカルバモイル基、2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニルチオカルバモイル基等のフェニル環上に置換基としてハロゲンが1~5個置換していてもよいフェニルチオカルバモイル基が挙げられる。

C1~8のアルコキシカルボニル基としては、例えば、メトキシカルボニル基、 エトキシカルボニル基、n-プロポキシカルボニル基、n-ペンチルオキシカル ボニル基、n-ヘキシルオキシカルボニル基、n-ヘプチルオキシカルボニル基、 n-オクチルオキシカルボニル基等を挙げることができる。

フェニルC1~6アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、 C1~6アルコキシカルボニル基、置換基としてC1~6アルコキシカルボニル 基を有していてもよいアミノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1〜6アルキ ル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基、ニトロ基及びC1 ~6アルキルチオ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していて もよい)としては、例えば、ベンジルオキシカルボニル基、1-フェネチルオキ シカルボニル基、2-フェネチルオキシカルボニル基、3-フェニルプロポキシ カルボニル基、2-フェニルプロポキシカルボニル基、4-フェニルブトキシカ ルボニル基、5-フェニルペンチルオキシカルボニルル基、4-フェニルペンチ ルオキシカルボニル基、6-フェニルヘキシルオキシカルボニル基、2-フルオ ロベンジルオキシカルボニル基、3-フルオロベンジルオキシカルボニル基、4 - フルオロベンジルオキシカルボニル基、2-クロロベンジルオキシカルボニル 基、3-クロロベンジルオキシカルボニル基、4-クロロベンジルオキシカルボ ニル基、2-ブロモベンジルオキシカルボニル基、3-ブロモベンジルオキシカ ルボニル基、4ーブロモベンジルオキシカルボニル基、2-ヨードベンジルオキ シカルボニル基、3-ヨードベンジルオキシカルボニル基、4-ヨードベンジル オキシカルボニル基、2、3-ジフルオロベンジルオキシカルボニル基、3、4 - ジフルオロベンジルオキシカルボニル基、3,5-ジフルオロベンジルオキシ

カルボニル基、2,4-ジフルオロベンジルオキシカルボニル基、2.6-ジフ ルオロベンジルオキシカルボニル基、2,4,6-トリフルオロベンジルオキシ カルボニル基、2,3,4,5,6-ペンタフルオロベンジルオキシカルボニル 基、3,4,5ートリフルオロベンジルオキシカルボニル基、2,3-ジクロロ 5 ベンジルオキシカルボニル基、3,4-ジクロロベンジルオキシカルボニル基、 3,5-ジクロロベンジルオキシカルボニル基、2,4-ジクロロベンジルオキ シカルボニル基、2,6-ジクロロベンジルオキシカルボニル基、2,4,6-トリクロロベンジルオキシカルボニル基、3,4,5ートリクロロベンジルオキ シカルボニル基、2-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、3-メ チルベンジルオキシカルボニル基、2、4-ジメチルベンジルオキシカルボニル 基、2、4、6-トリメチルベンジルオキシカルボニル基、3-ジフルオロメチ ルベンジルオキシカルボニル基、4-ジフルオロメチルベンジルオキシカルボニ ル基、4ークロロー3ージフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、3ーク ロロー4ージフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、3ーブロモー4ージ 15 フルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、3,5-ジフルオロー4-ジフル オロメチルベンジルオキシカルボニル基、3,5-ジトリフルオロメチルベンジ ルオキシカルボニル基、3-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、 4-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、4-フルオロ-3-トリ フルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、3-フルオロー4-トリフルオロ 20 メチルベンジルオキシカルボニル基、2-ペンタフルオロエチルベンジルオキシ カルボニル基、4ークロロー3ーペンタフルオロエチルベンジルオキシカルボニ ル基、3-クロロ-4-ペンタフルオロエチルベンジルオキシカルボニル基、2 ーペンタフルオロエチルベンジルオキシカルボニル基、3ーペンタフルオロエチ ルベンジルオキシカルボニル基、4-ペンタフルオロエチルベンジルオキシカル ボニル基、3-メトキシベンジルオキシカルボニル基、2,4-ジメトキシベン 25ジルオキシカルボニル基、2,4,6-トリメトキシベンジルオキシカルボニル 基、2-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、3-トリフルオロ メトキシベンジルオキシカルボニル基、4-トリフルオロメトキシベンジルオキ シカルボニル基、4-フルオロ-3-トリフルオロメトキシベンジルオキシカル

ボニル基、3-フルオロー4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル 基、2-ペンタフルオロエトキシベンジルオキシカルボニル基、3-ペンタフル オロエトキシベンジルオキシカルボニル基、4-ペンタフルオロエトキシベンジ ルオキシカルボニル基、3-クロロー4-トリフルオロメトキシベンジルオキシ カルボニル基、3-クロロー4ーペンタフルオロエトキシベンジルオキシカルボ ニル基、2-(2-トリフルオロメチルフェニル)エトキシカルボニル基、2-(3-トリフルオロメチルフェニル) エトキシカルボニル基、2-(4-トリフ ルオロメチルフェニル) エトキシカルボニル基、2-(4-トリフルオロメトキ シフェニル) エトキシカルボニル基、2-(2-ペンタフルオロエトキシフェニ 10 ル) エトキシカルボニル基、2-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル) エト キシカルボニル基、2-(4-ペンタフルオロエトキシフェニル)エトキシカル ボニル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシカルボニル基、 3-(3-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(2-トリフルオ 15 ロメチルフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(3-トリフルオロメトキシ フェニル)プロポキシカルボニル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニ ル) プロポキシカルボニル基、3-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル) プ ロポキシカルボニル基、3-(4-ペンタフルオロエトキシフェニル) プロポキ シカルボニル基、4-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)ブトキシカルボ ニル基、5- (4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチルオキシカルボニル基、 20 4- (4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチルオキシカルボニル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ペンチルオキシカルボニル基、6-(3 ートリフルオロメチルフェニル) ヘキシルオキシカルボニル基、6-(4-トリ フルオロメチルフェニル)ヘキシルオキシカルボニル基、6-(4-トリフルオ 25 ロメトキシフェニル)へキシルオキシカルボニル基、2-メチルチオベンジルオ キシカルボニル基、3-メチルチオベンジルオキシカルボニル基、4-メチルチ オベンジルオキシカルボニル基、2-(2-メチルチオフェニル)エトキシカル ボニル基、2-(3-メチルチオフェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-メチルチオフェニル) エトキシカルボニル基、3- (4-メチルチオフェニル)

プロポキシカルボニル基、4-(4-メチルチオフェニル)ブトキシカルボニル 基、5-(4-メチルチオフェニル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(4-メチルチオフェニル) ヘキシルオキシカルボニル基、2-メトキシカルボニルベ ンジルオキシカルボニル基、3-メトキシカルボニルベンジルオキシカルボニル 基、4-メトキシカルボニルベンジルオキシカルボニル基、2-(2-メトキシ カルボニルフェニル)エトキシカルボニル基、2-(3-メトキシカルボニルフ エニル) エトキシカルボニル基、2-(4-メトキシカルボニルフェニル) エト キシカルボニル基、3-(4-メトキシカルボニルフェニル)プロポキシカルボ ニル基、4-(4-メトキシカルボニルフェニル)ブトキシカルボニル基、5-(4-メトキシカルボニルフェニル) ペンチルオキシカルボニル基、6-(4-10 メトキシカルボニルフェニル) ヘキシルオキシカルボニル基、4-n-ペンチル オキシカルボニルアミノベンジルオキシカルボニル基、4-エトキシカルボニル アミノベンジルオキシカルボニル基、4-プロポキシカルボニルアミノベンジル オキシカルボニル基、4-tertーブトキシカルボニルアミノベンジルオキシ カルボニル基、2- (n-ヘキシルオキシカルボニルアミノフェニル) エトキシ 15 カルボニル基、3- (4-tert-ブトキシカルボニルアミノフェニル) プロ ポキシカルボニル基、4-(4-tert-ブトキシカルボニルアミノフェニ ル) ブトキシカルボニル基、5-(4-tert-ブトキシカルボニルアミノフ ェニル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(4-tertーブトキシカルボニ ルアミノフェニル)へキシルオキシカルボニル基、2-ニトロベンジルオキシカ 20 ルボニル基、3-ニトロベンジルオキシカルボニル基、4-ニトロベンジルオキ シカルボニル基、2-(2-ニトロフェニル)エトキシカルボニル基、2-(3 ーニトロフェニル) エトキシカルボニル基、2-(4-ニトロフェニル) エトキ シカルボニル基、3-(2,4-ジニトロフェニル)プロポキシカルボニル基、 4- (4-ニトロフェニル) ブトキシカルボニル基、5- (4-ニトロフェニ ル) ペンチルオキシカルボニル基、6-(2,4,6-トリニトロフェニル) へ キシルオキシカルボニル基、2-アミノベンジルオキシカルボニル基、3-アミ ノベンジルオキシカルボニル基、4-アミノベンジルオキシカルボニル基、2-(2-アミノフェニル) エトキシカルボニル基、2-(2,3-ジアミノフェニ

- ル) エトキシカルボニル基、2-(4-アミノフェニル) エトキシカルボニル基、 3-(2,4,6-トリアミノフェニル)プロポキシカルボニル基、4-(4-アミノフェニル) ブトキシカルボニル基、5-(4-アミノフェニル) ペンチル オキシカルボニル基、6-(4-アミノフェニル)へキシルオキシカルボニル基、 2-エトキシカルボニルベンジルオキシカルボニル基、3-エトキシカルボニル ベンジルオキシカルボニル基、4-メトキシカルボニルベンジルオキシカルボニ ル基、2-(2-エトキシカルボニルフェニル)エトキシカルボニル基、2-(3-エトキシカルボニルフェニル) エトキシカルボニル基、2-(4-エトキ シカルボニルフェニル)エトキシカルボニル基、3-(4-n-ブトキシカルボ ニルフェニル)プロポキシカルボニル基、4-(4-n-ペンチルオキシカルボ 10 ニルフェニル) ブトキシカルボニル基、5-(4-n-ヘキシルオキシカルボニ ルフェニル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(4-エトキシカルボニルフェ ニル)へキシルオキシカルボニル基等のフェニルC1~6アルコキシカルボニル 基(フェニル環上には、ハロゲン原子、C1~6アルコキシカルボニル基、置換 基としてC1~6アルコキシカルボニル基を有していてもよいアミノ基、ハロゲ 15 ン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基、ニトロ基及びC1~6アルキルチオ基からなる群より選ば れた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい)を挙げることがで きる。
- 20 ベンズヒドリルオキシカルボニル基(フェニル環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい)としては、例えば、ベンズヒドリルオキシカルボニル基、3ーフルオロベンズヒドリルオキシカルボニル基、4ーフルオロベンズヒドリルオキシカルボニル基、3,3'ージフルオロベンズヒドリルオキシカルボニル基、3,4'ージフルオロベンズヒドリルオキシカルボニル基、4,
- 25 4'-ジフルオロベンズヒドリルオキシカルボニル基、3,4,4'-トリフル オロベンズヒドリルオキシカルボニル基、3,3',4,4'-テトラフルオロ ベンズヒドリルオキシカルボニル基、2,2',4,4'-テトラフルオロベン ズヒドリルオキシカルボニル基、3,3',5,5'-テトラフルオロベンズヒ ドリルオキシカルボニル基、3,7,5,5'-テトラフルオロベンズヒ ドリルオキシカルボニル基、3-クロロベンズヒドリルオキシカルボニル基、4

ークロロベンズヒドリルオキシカルボニル基、3,3'ージクロロベンズヒドリルオキシカルボニル基、3,4'ージクロロベンズヒドリルオキシカルボニル基、4,4'ージクロロベンズヒドリルオキシカルボニル基、3,4,4'ートリクロロベンズヒドリルオキシカルボニル基、3,3',4,4'ーテトラクロロベンズヒドリルオキシカルボニル基、2,2',4,4'ーテトラクロロベンズヒドリルオキシカルボニル基、2,2',4,4'ーテトラクロロベンズヒドリルオキシカルボニル基、3,3',5,5'ーテトラクロロベンズヒドリルオキシカルボニル基等のベンズヒドリルオキシカルボニル基(フェニル環上にはハロゲン原子が1~4個置換していてもよい)を挙げることができる。

フェニル置換もしくは非置換のフェニルC1~6アルコキシカルボニル基とし 10 ては、例えば、ベンジルオキシカルボニル基、1-フェニルエトキシカルボニル 基、2-フェニルエトキシカルボニル基、3-フェニルプロポキシカルボニル基、 2-フェニルプロポキシカルボニル基、4-フェニルブトキシカルボニル基、5 -フェニルペントキシカルボニル基、4-フェニルペントキシカルボニル基、6 ーフェニルヘキシルオキシカルボニル基、2-ビフェニリルメトキシカルボニル 基、2-(2-ビフェニリル)エトキシカルボニル基、3-(2-ビフェニリ 15 ル)プロポキシカルボニル基、4-(2-ビフェニリル)ブトキシカルボニル基、 5-(2-ビフェニリル)ペントキシカルボニル基、6-(2-ビフェニリル) ヘキシルオキシカルボニル基、3-ビフェニリルメトキシカルボニル基、2-(3-ビフェニリル)エトキシカルボニル基、3-(3-ビフェニリル)プロポ キシカルボニル基、4-(3-ビフェニリル)ブトキシカルボニル基、5-(3 20 - ビフェニリル)ペントキシカルボニル基、6-(3-ビフェニリル)へキシル オキシカルボニル基、4-ビフェニリルメトキシカルボニル基、2-(4-ビフ エニリル) エトキシカルボニル基、3-(4-ビフェニリル) プロポキシカルボ ニル基、4-(4-ビフェニリル)ブトキシカルボニル基、5-(4-ビフェニ 25 リル)ペントキシカルボニル基、6-(4-ビフェニリル)へキシルオキシカル

ピリジルC1~6アルコキシカルボニル基としては、例えば、2ーピリジルメトキシカルボニル基、3ーピリジルメトキシカルボニル基、4ーピリジルメトキシカルボニル基、2-(3ーピリジル)エトキシカルボニル基、2-(3ーピリ

ボニル基等を挙げることができる。

ジル)エトキシカルボニル基、2-(4-ピリジル)エトキシカルボニル基、3-(2-ピリジル)プロポキシカルボニル基、3-(3-ピリジル)プロポキシカルボニル基、4-(2-ピリジル)ブトキシカルボニル基、4-(2-ピリジル)ブトキシカルボニル基、4-(2-ピリジル)ブトキシカルボニル基、4-(4-ピリジル)ブトキシカルボニル基、5-(2-ピリジル)ペンチルオキシカルボニル基、5-(3-ピリジル)ペンチルオキシカルボニル基、5-(4-ピリジル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(2-ピリジル)ヘキシルオキシカルボニル基、6-(4-ピリジル)ヘキシルオキシカルボニル基、6-(4-ピリジル)ヘキシルオキシカルボニル基、6-(4-ピリジル)ヘキシルオキシカルボニル基等を挙げることができる。

10 C1~6アルコキシ置換C1~6アルコキシカルボニル基としては、例えば、メトキシメトキシカルボニル基、メトキシメエトキシカルボニル基、1-エトキシエトキシカルボニル基、n-プロポキシメトキシカルボニル基、n-ブトキシメトキシカルボニル基、n-ベンチルオキシメトキシカルボニル基、n-ヘキシルオキシメトキシカルボニル基、2-エトルオキシメトキシカルボニル基、2-エトキシエトキシカルボニル基、2-エトキシオトキシカルボニル基、2-エトキシメトキシカルボニル基、1-プトキシメトキシカルボニル基、n-ベンチルオキシメトキシカルボニル基、n-ベキシルオキシメトキシカルボニル基、3-メトキシプロポキシカルボニル基、4-メトキシブトキシカルボニル基、5-メトキシペンチルオキシカルボニル基、6-メトキシヘキシルオキシカルボニル基等を挙げることができる。

20 ピペラジニルC1~6アルコキシカルボニル基(ピペラジン環上には、C1~6アルコキシカルボニル基及びフェニルC1~6アルコキシカルボニル基[フェニル環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい]からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、(1ーピペラジニル)メトキシカルボニル基、2-(2ーピペラジニル)エトキシカルボニル基、1-(3ーピペラジニル)エトキシカルボニル基、3-(4ーピペラジニル)プロポキシカルボニル基、4-(1ーピペラジニルブトキシカルボニル基、5-(2ーピペラジニル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(3ーピペラジニル)ヘキシルオキシカルボニル基、2ーメチル-3-(1ーピペラジニル)プロポキシカルボニル基、1,1ージメチル-2-(4ーピペラジニル)

エトキシカルボニル基、2-(1-ピペラジニル)エトキシカルボニル基、2-(4-メトキシカルボニル-1-ピペラジニル) エトキシカルボニル基、2-(4-エトキシカルボニル-1-ピペラジニル) エトキシカルボニル基、2-(4-n-プロポキシカルボニル-1-ピペラジニル) エトキシカルボニル基、 2-(4-tert-ブトキシカルボニル-1-ピペラジニル) エトキシカルボ ニル基、2-(4-sec-ブトキシカルボニル-1-ピペラジニル)エトキシ カルボニル基、2-(4-n-ペンチルオキシカルボニル-1-ピペラジニル) エトキシカルボニル基、2-(4-n-ヘキシルオキシカルボニル-1-ピペラ ジニル)エトキシカルボニル基、2-(4-ベンジルオキシカルボニル-1-ピ ペラジニル) エトキシカルボニル基、2- (4-フェニルエトキシカルボニル-1-ピペラジニル)エトキシカルボニル基、2-(4-(3-フェニルプロポキ シカルボニル) -1-ピペラジニル) エトキシカルボニル基、2-(4-(2-フルオロベンジルオキシカルボニル) -1-ピペラジニル) エトキシカルボニル 基、2-(4-(4-フルオロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニ 15 ル)エトキシカルボニル基、2-(4-(4-クロロベンジルオキシカルボニ ル) -1-ピペラジニル) エトキシカルボニル基、2-(4-(3-クロロベン ジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)エトキシカルボニル基、2-(4 (2-ブロモベンジルオキシカルボニル) -1-ピペラジニル) エトキシカル ボニル基、2-(4-(2-クロロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジ ニル)エトキシカルボニル基、2-(4-(3,4-ジフルオロベンジルオキシ 20 カルボニル) -1-ピペラジニル) エトキシカルボニル基、2-(4-(2, 3, 3))4, 5, $6 - ^{\circ}$ ンタフルオロベンジルオキシカルボニル) $-1 - ^{\circ}$ ピペラジニル) メトキシカルボニル基、2-(4-(2,4-ジクロロベンジルオキシカルボニ ル) -1-ピペラジニル) エトキシカルボニル基、2-(4-(2,4,6-ト 25 リクロロベンジルオキシカルボニル) -1-ピペラジニル) エトキシカルボニル 基、(3,4-メトキシカルボニル-1-ピペラジニル)メトキシカルボニル基、 (2, 5-メトキシカルボニルー4-ベンジルオキシカルボニルー1-ピペラジ ニル)メトキシカルボニル基等のピペラジニルC1~6アルコキシカルボニル基 (ピペラジン環上には、置換基としてC1~6アルコキシカルボニル基及びフェ

ニル環上に置換基としてハロゲン原子を $1\sim5$ 個有することのあるフェニル $C1\sim6$ アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれた基が $1\sim3$ 個置換していてもよい。)を挙げることができる。

フェノキシカルボニル基(フェニル環上には、C1~6アルキル基及びC1~ 6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換されていても 5 よい)としては、例えば、フェノキシカルボニル基、2-メチルフェノキシカル ボニル基、3-メチルフェノキシカルボニル基、4-メチルフェノキシカルボニ ル基、2-エチルフェノキシカルボニル基、3-エチルシフェノキシカルボニル 基、4-エチルフェノキシカルボニル基、4-プロピルフェノキシカルボニル基、 4-tertーブチルフェノキシカルボニル基、4-ブチルフェノキシカルボニ 10 ル基、2、3ージメチルフェノキシカルボニル基、3,4,5ートリメチルフェ ノキシカルボニル基、4ーペンチルフェノキシカルボニル基、4ーヘキシルフェ ノキシカルボニル基、2-メトキシフェノキシカルボニル基、3-メトキシフェ ノキシカルボニル基、4-メトキシフェノキシカルボニル基、2-エトキシフェ ノキシカルボニル基、3-エトキシフェノキシカルボニル基、4-エトキシフェ 15 ノキシカルボニル基、4-プロポキシフェノキシカルボニル基、4-tert-ブトキシフェノキシカルボニル基、4-n-ブトキシフェノキシカルボニル基、 2、3-ジメトキンフェノキシカルボニル基、3,4,5-トリメトキシフェノ キシカルボニル基、4-ペントキシフェノキシカルボニル基、4-ヘキシルオキ シフェノキシカルボニル基、2-メチル-4-メトキシフェノキシカルボニル基 20 等のフェノキシカルボニル基(フェニル環上には、C1~6アルキル基及びC1 ~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~3個置換されていてもよい) を挙げることができる。

ベンゾイル基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6ア ルキル基が少なくとも1個置換していてもよい)としては、例えば、ベンゾイル 基、2-メチルベンゾイル基、3-メチルベンゾイル基、4-メチルベンゾイル 基、4-エチルベンゾイル基、4-n-プロピルベンゾイル基、4-tert-ブチルベンゾイル基、4-n-ペンチルベンゾイル基、4-n-ヘキシルベンゾ イル基、2、3-ジメチルベンゾイル基、3、4-ジメチルベンゾイル基、2、 4,6-トリメチルベンゾイル基、2-トリフルオロメチルベンゾイル基、3-トリフルオロメチルベンゾイル基、4-トリフルオロメチルベンゾイル基、4-ペンタフルオロエチルベンゾイル基、2,3-ジトリフルオロメチルベンゾイル基、3,4-ジトリフルオロメチルベンゾイル基等のベンゾイル基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基が1~3個置換してもよい)を挙げることができる。

フェニルC2~6アルカノイル基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは 未置換のC1~6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい)としては、 例えば、フェニルアセチル基、3-フェニルプロピオニル基、4-フェニルブチ リル基、5-フェニルペンタノイル基、6-フェニルヘキサノイル基、2-メチ 10 ルフェニルアセチル基、3-メチルフェニルアセチル基、4-メチルフェニルア セチル基、2ートリフルオロメチルフェニルアセチル基、3-トリフルオロメチ ルフェニルアセチル基、4-トリフルオロメチルフェニルアセチル基、3-(2. 4-ジメチルフェニル)プロピオニル基、(2, 4, 6-トリメチルフェニル) アセチル基、3-(2-メチルフェニル)プロピオニル基、3-(3-メチルフ 15 エニル)プロピオニル基、3-(4-メチルフェニル)プロピオニル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル) プロピオニル基、3-(3-トリフルオロ メチルフェニル)プロピオニル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プ ロピオニル基、3-(3,5-ジメチルフェニル)プロピオニル基、4-(4-20 トリフルオロメチルフェニル) ブチリル基、5-(4-トリフルオロメチルフェ ニル) ペンタノイル基、6-(3,5-ジトリフルオロメチルフェニル) ヘキサ ノイル基、4- (4-トリフルオロメチルフェニル) ブチリル基、5- (4-ペ ンタフルオロエチルフェニル)ペンタノイル基、6-(4-ペンタフルオロエチ ルフェニル) ヘキサノイル基等のフェニルC2~6アルカノイル基(フェニル環 25 上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基が1~3個置換され

フェノキシC2~6アルカノイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子が1~3個置換していてもよい)としては、例えば、フェノキシアセチル基、3-フェノキシプロピオニル基、4-フェノキシブチリル基、5-フェノキシペンタノイ

ていてもよい)を挙げることができる。

ル基、6-フェノキシヘキサノイル基、4-(4-クロロフェノキシ) ブチリル 基、5-(4-クロロフェノキシ)ペンタノイル基、6-(4-クロロフェノキ シ) ヘキサノイル基、2-フルオロフェノキシアセチル基、3-フルオロフェノ キシアセチル基、4ーフルオロフェノキシアセチル基、2-クロロフェノキシア 5 セチル基、3-クロロフェノキシアセチル基、4-クロロフェノキシアセチル基、 4-ブロモフェノキシアセチル基、2、3-ジフルオロフェノキシアセチル基、 2-フルオロー4-クロロフェノキシアセチル基、3,5-ジフルオロフェノキ シアセチル基、2,4,6-トリクロロフェノキシアセチル基、3-(2-フル オロフェノキシ)プロピオニル基、3-(3-フルオロフェノキシ)プロピオニ ル基、3-(4-フルオロフェノキシ)プロピオニル基、3-(2-クロロフェ 10 ノキシ)プロピオニル基、3-(3-クロロフェノキシ)プロピオニル基、3-(4-クロロフェノキシ) プロピオニル基、3-(4-ブロモフェノキシ) プロ ピオニル基、3-(2,3-ジフルオロフェノキシ)プロピオニル基、3-(2 - フルオロー 4 - クロロフェノキシ) プロピオニル基、3 - (3, 5 - ジフルオ ロフェノキシ)プロピオニル基、4-(4-フルオロフェノキシ)ブチリル基、 15 5- (4-ブロモフェノキシ)ペンタノイル基、6-(4-クロロフェノキシ) ヘキサノイル基、4-(4-クロロフェノキシ)ブチリル基、5-(4-ヨード フェノキシ)ペンタノイル基、6-(4-クロロフェノキシ)ヘキサノイル基等 を挙げることができる。

20 ピペラジニルC2~6アルカノイル基(ピペラジン環上には、C1~6アルカノイル基、フェニルC1~6アルキル基[フェニル環上には、フェニル基、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基を少なくとも1種が置換していてもよい]、フェニルC1~6アルコキシカルボニル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基を少なくとも1種が置換していてもよい]、フェニルカルバモイルC1~6アルキル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基

からなる群より選ばれた基を少なくとも1種が置換していてもよい]、フェニル カルバモイル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置 換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ 基からなる群より選ばれた基を少なくとも1種が置換していてもよい〕及びベン - ゾオキサゾリル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していても よい)としては、例えば、1ーピペラジニルアセチル基、3- (2-ピペラジニ ル) プロパノイル基、4-(3-ピペラジニル) ブチリル基、4-(4-ピペラ ジニル)ペンタノイル基、5-(1-ピペラジニル)ペンタノイル基、6-(2 ーピペラジニル) ヘキサノイル基、4-アセチル-1-ピペラジニルアセチル基、 3-(4-プロピオニル-1-ピペラジニル)プロピオニル基、3-(4-ブチ 10 リルー1ーピペラジニル)ブチリル基、4-(4-ペンタノイル-1-ピペラジ ニル)ブチリル基、5-(4-ヘキサノイルー1-ピペラジニル)ペンタノイル 基、6-(4-アセチルー1-ピペラジニル)へキサノイル基、4-ベンジルー 1ーピペラジニルアセチル基、3-「4-(2-フェニルエチル)-1-ピペラ ジニル] プロピオニル基、(4ーアセチルー3ーベンジルー1ーピペラジニル) 15 アセチル基、(4 -ベンジルオキシカルボニル-2-ベンジル-1-ピペラジニ ル) アセチル基、(4-フェニルカルバモイル-2,6-ジベンジル-1-ピペ ラジニル)アセチル基、4-「4-(1-フェニルエチル)-1-ピペラジニ ル] ブチリル基、 [4-(3-フェニルプロピル) 1-ピペラジニル] ブチリル 20 基、5-「4-(5-フェニルペンチル)-1-ピペラジニル]ペンタノイル基、 6- [4-(6-フェニルヘキシル)-1-ピペラジニル] ヘキサノイル基、4 - (4-フェニルベンジル) - 1 - ピペラジニルアセチル基、3 - 「4- (3-フルオロベンジル)-1-ピペラジニル] プロピオニル基、4-[4-(2,3, 4, 5, 6ーペンタフルオロベンジル) -1ーピペラジニル] ブチリル基、4-25 [4-(2,4-ジクロロベンジル)-1-ピペラジニル]ブチリル基、5-[4-(2, 4, 6-トリクロロベンジル)-1-ピペラジニル]ペンタノイル 基、6-「4-(4-メチルベンジル)-1-ピペラジニル〕へキサノイル基、 「4-(4-トリフルオロメチルベンジル)-1-ピペラジニル]アセチル基、 [4-(3,5-ジトリフルオロメチルベンジル)-1-ピペラジニル] アセチ

ル基、[4-(2,3-ジメチルベンジル)-1-ピペラジニル]アセチル基、 [4-(2,4,6-)] アセチルベンジル) -1-ピペラジニル] アセチル基、 6-「4-(4-メトキシベンジル)-1-ピペラジニル]へキサノイル基、 「4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)-1-ピペラジニル]アセチル基、 「4-(3,5-ジトリフルオロメトキシベンジル)-1-ピペラジニル]アセ 5 チル基、[4-(2,3-ジメトキシベンジル)-1-ピペラジニル]アセチル 基、[4-(2,4,6-トリメトキシベンジル)-1-ピペラジニル]アセチ ル基、3-(4-ベンジルオキシカルボニル-1-ピペラジニル)プロピオニル 基、4-(2,4-ジクロロベンジルオキシカルボニル-1-ピペラジニル)ア セチル基、3-(4-ベンジルオキシカルボニル-1-ピペラジニル)ブチリル 10 基、4-(4-ベンジルオキシカルボニル-1-ピペラジニル)ブチリル基、5 (4-ベンジルオキシカルボニル-1-ピペラジニル)ペンタノイル基、6-(4-ベンジルオキシカルボニル-1-ピペラジニル) ヘキサノイル基、3-(4-(2-フルオロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)プロピ オニル基、3-(4-(2-フルオロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラ 15 ジニル)ブチリル基、4-(4-(2-フルオロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル) ブチリル基、5-(4-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフル オロベンジルオキシカルボニル) -1-ピペラジニル) ペンタノイル基、6-(4-フルオロベンジルオキシカルボニル-1-ピペラジニル) ヘキサノイル基、 3-(4-(2, 3-ジフルオロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニ 20 ル) ブチリル基、4-(4-(3-フルオロベンジルオキシカルボニル) -1-ピペラジニル)ブチリル基、5-(4-(3-フルオロベンジルオキシカルボニ ル) -1-ピペラジニル) ペンタノイル基、3-(4-(4ーフルオロベンジル オキシカルボニル) -1-ピペラジニル) ブチリル基、4-(4-(4-フルオ 25 ロベンジルオキシカルボニル) -1-ピペラジニル) ブチリル基、5-(4-(4-フルオロベンジルオキシカルボニル) -1-ピペラジニル) ペンタノイル 基、6-(4-(4-フルオロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニ ル) ヘキサノイル基、3-(4-(2-クロロベンジルオキシカルボニル)-1 - ピペラジニル)プロピオニル基、3 - (4 - (2 - クロロベンジルオキシカル

ボニル) -1-ピペラジニル) ブチリル基、4-(4-(2-クロロベンジルオ キシカルボニル) -1-ピペラジニル) ブチリル基、5-(4-(2-クロロベ ンジルオキシカルボニル) -1-ピペラジニル) ペンタノイル基、6-(2,4, 6-トリクロロベンジルオキシカルボニル-1-ピペラジニル)へキサノイル基、 3-(4-(3-クロロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)プロ ピオニル基、3-(4-(3-クロロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラ ジニル)ブチリル基、4-(4-(3-クロロベンジルオキシカルボニル)-1 - ピペラジニル)ブチリル基、5-(4-(3-クロロベンジルオキシカルボニ ル) -1-ピペラジニル) ペンタノイル基、6-(3-クロロベンジルオキシカ 10 ルボニルー1ーピペラジニル) ヘキサノイル基、2-(4-(4-クロロベンジ ルオキシカルボニル) -1-ピペラジニル) プロピオニル基、3-(4-(4-クロロベンジルオキシカルボニル) -1-ピペラジニル) ブチリル基、4-(4 (4-クロロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)ブチリル基、 5-(4-(4-クロロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)ペン タノイル基、6-(4-クロロベンジルオキシカルボニル-1-ピペラジニル) 15 ヘキサノイル基、(4-(2-メチルベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラ ジニル) アセチル基、(4-(2,4-ジメチルベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)アセチル基、(4-(2,4,6-トリメチルベンジルオキ シカルボニル) -1-ピペラジニル) アセチル基、(4-(2-メトキシベンジ ルオキシカルボニル) -1-ピペラジニル) アセチル基、(4-(2、4-ジメ 20 トキシベンジルオキシカルボニル) -1-ピペラジニル) アセチル基、(4-(2, 4, 6-トリメトキシベンジルオキシカルボニル) -1-ピペラジニル) アセチル基、4-(3,5-ジトリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル)アセチル基、4 - (3,5-ジトリフルオロメトキシベン 25 ジルオキシカルボニル) -1-ピペラジニル) アセチル基、3-(4-(2-ト リフルオロメチルベンジルオキシカルボニル) -1-ピペラジニル) プロピオニ ル基、3-(4-(2-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル) ブチリル基、4-(4-(2-トリフルオロメチルベンジルオキ シカルボニル) -1-ピペラジニル) ブチリル基、5-(4-(2-トリフルオ

ロメチルベンジルオキシカルボニル) -1-ピペラジニル) ペンタノイル基、6 - (4-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニルー1ーピペラジニル)へ キサノイル基、3-(4-(3-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニ ル) - 1 - ピペラジニル) ブチリル基、 4 - (4 - (3 - トリフルオロメチルベ ンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)ブチリル基、5-(4-(3-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル) -1-ピペラジニル) ペンタノ イル基、3- (4- (4-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル)-1 - ピペラジニル) ブチリル基、4- (4- (4- トリフルオロメチルベンジルオ キシカルボニル) -1-ピペラジニル) ブチリル基、5-(4-(4-トリフル 10 オロメチルベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)ペンタノイル基、 6-(4-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラ ジニル) ヘキサノイル基、2-(4-(2-トリフルオロメトキシベンジルオキ シカルボニル) -1-ピペラジニル) プロピオニル基、3-(4-(2-トリフ ルオロメトキシベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) ブチリル基、 4- (4- (2-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル) -1-ピペ 15 ラジニル)ブチリル基、5-(4-(2-トリフルオロメトキシベンジルオキシ カルボニル) -1-ピペラジニル) ペンタノイル基、6-(4-トリフルオロメ トキシベンジルオキシカルボニル-1-ピペラジニル) ヘキサノイル基、3-(4-(3-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジ ニル)ブチリル基、4-(4-(3-トリフルオロメトキシベンジルオキシカル 20 ボニル) -1-ピペラジニル) ブチリル基、5-(4-(3-トリフルオロメト キシベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)ペンタノイル基、3-(4-(4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル) -1-ピペラジ ニル) ブチリル基、4-(4-(4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカル ボニル) -1-ピペラジニル) ブチリル基、5-(4-(4-トリフルオロメト 25 キシベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)ペンタノイル基、6-(4-(4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル) -1-ピペラジ ニル) ヘキサノイル基、4-フェニルカルバモイルメチル-1-ピペラジニルア セチル基、3-(4-フェニルカルバモイルメチル-1-ピペラジニル)プロピ

オニル基、4-(4-フルオロフェニルカルバモイルメチル)-1-ピペラジニ ルアセチル基、3-(4-(2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニルカル バモイルメチル) -1-ピペラジニル) プロピオニル基、4-(4-クロロフェ ニルカルバモイルメチル) -1-ピペラジニルアセチル基、3-(4-(3,4 ジクロロフェニルカルバモイルメチル)1ーピペラジニル)プロピオニル基、 4- (4-メチルフェニルカルバモイルメチル) -1-ピペラジニルアセチル基、 3-(4-(2, 4-ジメチルフェニルカルバモイルメチル) -1-ピペラジニ ル)プロピオニル基、4-(4-メトキシフェニルカルバモイルメチル)-1-ピペラジニルアセチル基、3-(4-(2,4,6-トリメトキシフェニルカル 10 バモイルメチル) -1-ピペラジニル) プロピオニル基、3-(4-(4-トリ フルオロメチルフェニルカルバモイルメチル) -1-ピペラジニル) プロピオニ ル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニルカルバモイルメチル)-1-ピ ペラジニルアセチル基、3-(4-(4-トリフルオロメトキシフェニルカルバ モイルメチル) -1-ピペラジニル) プロピオニル基、4-フェニルカルバモイ ルー1-ピペラジニルアセチル基、3-(4-フェニルカルバモイルー1-ピペ 15 ラジニル)プロピオニル基、4-(4-フルオロフェニルカルバモイル)-1-ピペラジニルアセチル基、3-(4-(2,3,4,5,6-ペンタフルオロフ ェニルカルバモイル) -1-ピペラジニル) プロピオニル基、4-(4-クロロ フェニルカルバモイル) -1-ピペラジニルアセチル基、4-(2,4-ジクロ ロフェニルカルバモイル) -1-ピペラジニルアセチル基、4-(2,6-トリ 20 クロロフェニルカルバモイル) -1-ピペラジニルアセチル基、3-(4-(4 ークロロフェニルカルバモイル) -1-ピペラジニル) プロピオニル基、4-(4-メチルフェニルカルバモイル) -1-ピペラジニルアセチル基、3-(4 (3,4ージメチルフェニルカルバモイル)ー1ーピペラジニル)プロピオニ ル基、4-(4-メトキシフェニルカルバモイル)-1-ピペラジニルアセチル 25 基、3-[4-(2,4,6-トリメトキシフェニルカルバモイル)-1-ピペ ラジニル] プロピオニル基、3-(4-(4-トリフルオロメチルフェニルカル バモイル) -1-ピペラジニル) プロピオニル基、4-(3,5-ジトリフルオ ロメトキシフェニルカルバモイル) -1-ピペラジニルアセチル基、3-(4-

(4-トリフルオロメトキシフェニルカルバモイル) -1-ピペラジニル) プロ ピオニル基、3-(4-(4-フルオロフェニルカルバモイル)-1-ピペラジ ニル)プロピオニル基、3-(4-(4-メチルフェニルカルバモイル)-1-ピペラジニル)プロピオニル基、3-(4-(4-メトキシフェニルカルバモイ ル)-1-ピペラジニル)プロピオニル基、4-(2-ベンゾオキサゾリル)-1-ピペラジニルアセチル基、3-(4-(2-ベンゾオキサゾリル)-1-ピ ペラジニル)プロピオニル基、4-(4-(2-ベンゾオキサゾリル)-1-ピ ペラジニル)プチリル基、5-(4-(2-ベンゾオキサゾリル)-1-ピペラ ジニル)ペンタノイル基、6-(4-(2-ベンゾオキサゾリル)-1-ピペラ 10 ジニル) ヘキサノイル基等のピペラジニルC2~6アルカノイル基 (ピペラジン 環上には、C1~6アルカノイル基、フェニル環上に置換基としてフェニル基、 ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン 置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基を1~5 個、好ましくは1~3個有することのあるフェニルC1~6アルキル基、フェニ ル環上に置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6ア 15 ルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群よ り選ばれた基を1~5個、好ましくは1~3個有することのあるフェニルC1~ 6アルコキシカルボニル基、フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、ハロゲ ン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基を1~5個、好ましくは1~3 20 個有することのあるフェニルカルバモイルC1~6アルキル基、フェニル環上に 置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基 及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれ た基を1~5個、好ましくは1~3個有することのあるフェニルカルバモイル基 及びベンジオキサゾリル基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していても 25 よい。)が挙げられる。

フェニルカルバモイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、置換基としてC 1~6アルキル基を有することのあるアミノ基、カルボキシル基、C1~6アル コキシカルボニル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロ

ゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基、ピペラジン環上に置換基とし てC1~6アルキル基を有することのあるピペラジニル基及びモルホリノ基から なる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい)としては、例えば、フェ ニルカルバモイル基、2-フルオロフェニルカルバモイル基、3-フルオロフェ 5 ニルカルバモイル基、4ーフルオロフェニルカルバモイル基、2ークロロフェニ ルカルバモイル基、3ークロロフェニルカルバモイル基、4ークロロフェニルカ ルバモイル基、2-ブロモフェニルカルバモイル基、3-ブロモフェニルカルバ モイル基、4ーブロモフェニルカルバモイル基、2ーヨードフェニルカルバモイ ル基、3-ヨードフェニルカルバモイル基、4-ヨードフェニルカルバモイル基、 2,3-ジフルオロフェニルカルバモイル基、3,4-ジフルオロフェニルカル 10 バモイル基、3,5-ジフルオロフェニルカルバモイル基、2,4-ジフルオロ フェニルカルバモイル基、2,6-ジフルオロフェニルカルバモイル基、2,3 ージクロロフェニルカルバモイル基、3、4ージクロロフェニルカルバモイル基、 3, 5-ジクロロフェニルカルバモイル基、2, 4-ジクロロフェニルカルバモ イル基、2、6ージクロロフェニルカルバモイル基、3、4、5ートリフルオロ 15 フェニルカルバモイル基、2,3-ジフルオロフェニルカルバモイル基、3,4, 5ートリクロロフェニルカルバモイル基、2,4,6ートリフルオロフェニルカ ルバモイル基、2、4、6ートリクロロフェニルカルバモイル基、2ーメチルフ ェニルカルバモイル基、3-メチルフェニルカルバモイル基、4-メチルフェニ ルカルバモイル基、2-メチルー3-クロロフェニルカルバモイル基、3-メチ 20 ルー4ークロロフェニルカルバモイル基、2ークロロー4ーメチルフェニルカル バモイル基、2-メチル-3-フルオロフェニルカルバモイル基、2-トリフル オロメチルフェニルカルバモイル基、3-トリフルオロメチルフェニルカルバモ イル基、4ートリフルオロメチルフェニルカルバモイル基、N-メチルーN-フ ェニルカルバモイル基、N- (2-フルオロフェニル) -N-メチルカルバモイ 25 ル基、N-(3-フルオロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(4-フルオロフェニル) - N-メチルカルバモイル基、N-(2-クロロフェニル) -N-メチルカルバモイル基、N-(3-クロロフェニル)-N-メチルカルバ モイル基、N-(4-クロロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(4

一ブロモフェニル) -N-メチルカルバモイル基、N-(2-ヨードフェニル) -N-メチルカルバモイル基、N-(3-ヨードフェニル)-N-メチルカルバ モイル基、N-(4-ヨードフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(2, 3-ジフルオロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(3, 4-ジフル オロフェニル) - N - メチルカルバモイル基、N - (3, 5 - ジフルオロフェニ ル) -N-メチルカルバモイル基、N-(2,4-ジフルオロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(2,6-ジフルオロフェニル)-N-メチルカル バモイル基、N-(2,3-ジクロロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、 N-(3, 4-ジクロロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(3, 5 一ジクロロフェニル) -N-メチルカルバモイル基、N-(2,4-ジクロロフ 10 ェニル) - N-メチルカルバモイル基、N-(2,6-ジクロロフェニル)-N -メチルカルバモイル基、N-(3,4,5-トリフルオロフェニル)-N-メ チルカルバモイル基、N-(3, 4, 5-トリクロロフェニル)-N-メチルカ ルバモイル基、N-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)-N-メチルカルバ モイル基、N-(2, 4, 6-トリクロロフェニル)-N-メチルカルバモイル 15 基、N-(2-メチルフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(3-メチ ルフェニル) -N-メチルカルバモイル基、N-(4-メチルフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(2-メチル-3-クロロフェニル)-n-メチル カルバモイル基、N-(3-メチル-4-クロロフェニル)-N-メチルカルバ モイル基、N-(2-クロロ-4-メチルフェニル)-N-メチルカルバモイル 20 基、N-(2-メチル-3-フルオロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、 N-(2-トリフルオロメチルフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(4-トリフルオロメチルフェニル) -N-メチルカルバモイル基、N-ベンジ ル-N-フェニルカルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-フルオロフェニ ル) カルバモイル基、Nーベンジル-N-(3-フルオロフェニル) カルバモイ 25 ル基、N-ベンジル-N-(4-フルオロフェニル)カルバモイル基、N-ベン ジル-N-(2-クロロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3-クロロフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(4-クロロフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-ブロモフェニル)カルバモイル基、

N-ベンジル-N-(3-ブロモフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N - (4-ブロモフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N- (2-ヨードフ ェニル) カルバモイル基、Nーベンジル-N-(3-ヨードフェニル) カルバモ イル基、N-ベンジル-N-(4-ヨードフェニル)カルバモイル基、N-ベン ジル-N-(2, 3-ジフルオロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N - (3, 4-ジフルオロフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3, 5 ージフルオロフェニル) カルバモイル基、Nーベンジル-N-(2, 4 - ジフ ルオロフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2,6-ジフルオロフ エニル) カルバモイル基、Nーベンジル-N-(2,3-ジクロロフェニル) カ ルバモイル基、N-ベンジル-N-(3, 4-ジクロロフェニル) カルバモイル 10 基、N-ベンジル-N-(3,5-ジクロロフェニル)カルバモイル基、N-ベ ンジルーN-(2,4-ジクロロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジルーN (2,6-ジクロロフェニル)カルバモイル基、NーベンジルーNー(3,4, 5ートリフルオロフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3,4,5 ートリクロロフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2,3-ジフル 15 オロフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2, 4, 6-トリクロロ フェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-メチルフェニル) カルバ モイル基、NーベンジルーNー(3ーメチルフェニル)カルバモイル基、Nーベ ンジルーN-(4-メチルフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2 20 - ーメチルー3-クロロフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3-メ チルー4ークロロフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-クロロ -4-メチルフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-メチル-3 -フルオロフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-トリフルオロ メチルフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3-トリフルオロメチ 25ルフェニル) カルバモイル基、NーベンジルーNー(4ートリフルオロメチルフ エニル)カルバモイル基、2ーペンタフルオロエチルフェニルカルバモイル基、 3-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイル基、4-ペンタフルオロエチル フェニルカルバモイル基、2-イソプロピルフェニルカルバモイル基、3-イソ プロピルフェニルカルバモイル基、4-イソプロピルフェニルカルバモイル基、

2-tert-ブチルフェニルカルバモイル基、3-tert-ブチルフェニル カルバモイル基、4-tertーブチルフェニルカルバモイル基、2-sec-ブチルフェニルカルバモイル基、3-sec-ブチルフェニルカルバモイル基、 4-sec-ブチルフェニルカルバモイル基、2-n-ヘプタフルオロプロピル - フェニルカルバモイル基、3-n-ヘプタフルオロプロピルフェニルカルバモイ ル基、4-n-ヘプタフルオロプロピルフェニルカルバモイル基、4-ペンチル フェニルカルバモイル基、4ーヘキシルフェニルカルバモイル基、2ーメトキシ フェニルカルバモイル基、3ーメトキシフェニルカルバモイル基、4ーメトキシ フェニルカルバモイル基、2ーメトキシー3-クロロフェニルカルバモイル基、 2-フルオロ-3-メトキシフェニルカルバモイル基、2-フルオロ-4-メト 10 キシフェニルカルバモイル基、2,6-ジメトキシフェニルカルバモイル基、2, 3, 4ートリフルオロフェニルカルバモイル基、3, 4, 5ートリフルオロフェ ニルカルバモイル基、2ートリフルオロメトキシフェニルカルバモイル基、3-トリフルオロメトキシフェニルカルバモイル基、4-トリフルオロメトキシフェ - ニルカルバモイル基、2-ペンタフルオロエトキシフェニルカルバモイル基、3 15 ーペンタフルオロエトキシフェニルカルバモイル基、4ーペンタフルオロエトキ シフェニルカルバモイル基、2-イソプロポキシフェニルカルバモイル基、3-イソプロポキシフェニルカルバモイル基、4-イソプロポキシフェニルカルバモ イル基、2-tertーブトキシフェニルカルバモイル基、3-tertーブト キシフェニルカルバモイル基、4-tert-ブトキシフェニルカルバモイル基、 20 2-sec-ブトキシフェニルカルバモイル基、3-sec-ブトキシフェニル カルバモイル基、4-sec-ブトキシフェニルカルバモイル基、2-n-ヘプ タフルオロプロポキシフェニルカルバモイル基、3-n-ヘプタフルオロプロポ キシフェニルカルバモイル基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニルカル バモイル基、4ーペンチルロキシフェニルカルバモイル基、4ーヘキシルオキシ 25 フェニルカルバモイル基、2ージメチルアミノフェニルカルバモイル基、2ーア ミノフェニルカルバモイル基、2,4-ジアミノフェニルカルバモイル基、2, 4, 6-トリアミノフェニルカルバモイル基、3-ジメチルアミノフェニルカル バモイル基、4ーメチルアミノフェニルカルバモイル基、2-カルボキシルフェ

ニルカルバモイル基、3-カルボキシルフェニルカルバモイル基、4-カルボキ シルフェニルカルバモイル基、2、3-ジカルボキシルフェニルカルバモイル基、 2, 4, 6-トリカルボキシルフェニルカルバモイル基、2-メトキシカルボニ ルフェニルカルバモイル基、3-メトキシカルボニルフェニルカルバモイル基、 5 4-メトキシカルボニルフェニルカルバモイル基、2-エトキシカルボニルフェ ニルカルバモイル基、3ーエトキシカルボニルフェニルカルバモイル基、4-エ トキシカルボニルフェニルカルバモイル基、2-プロポキシカルボニルフェニル カルバモイル基、3ープロポキシカルボニルフェニルカルバモイル基、4ープロ ポキシカルボニルフェニルカルバモイル基、2-(1-ピペラジニル)フェニル カルバモイル基、2-(2,4-ジメチル-1-ピペラジニル)フェニルカルバ 10 モイル基、2-(2,3,4-トリメチル-1-ピペラジニル)フェニルカルバ モイル基、2-(4-メチル-1-ピペラジニル)フェニルカルバモイル基、3 - (4-メチル-1-ピペラジニル)フェニルカルバモイル基、4-(4-メチ ルー1ーピペラジニル)フェニルカルバモイル基、2ーモルホリノフェニルカル 15 バモイル基、3-モルホリノフェニルカルバモイル基、4-モルホリノフェニル カルバモイル基等のフェニルカルバモイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、 . 置換基としてC1~6アルキル基を1~2個有することのあるアミノ基、カルボ キシル基、C1~6アルコキシカルボニル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基、ピペ ラジン環上に置換基としてC1~6アルキル基を1~3個有することのあるピペ 20 ラジニル基及びモルホリノ基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していて もよく、またアミノ基部分に他にC1~6アルキル基またはフェニルC1~6ア ルキル基が置換していてもよい)を挙げることができる。

フェニルC1~6アルキルカルバモイル基(フェニル環上には、ハロゲン置換 もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、ベンジルカルバモイル基、1ーフェニルエチルカルバモイル基、2ーフェニルエチルカルバモイル基、3ーフェニルプロピルカルバモイル基、4ーフェニルブチルカルバモイル

基 6-フェニルヘキシルカルバモイル基、2-メチル-3-フェニルプロピル カルバモイル基、1,1-ジメチル-2-フェニルエチルカルバモイル基、2-メチルベンジルカルバモイル基、3-メチルベンジルカルバモイル基、4-メチ ルベンジルカルバモイル基、2,4-ジメチルベンジルカルバモイル基、2,4, 6-トリメチルベンジルカルバモイル基、4-トリフルオロメチルー3-メトキ シベンジルカルバモイル基、2-エチルベンジルカルバモイル基、3-エチルベ ンジルカルバモイル基、4-エチルベンジルカルバモイル基、2-イソプロピル ベンジルカルバモイル基、3-イソプロピルベンジルカルバモイル基、4-イソ プロピルベンジルカルバモイル基、2、4-ジメトキシベンジルカルバモイル基、 2, 4, 6-トリメトキシベンジルカルバモイル基、4-トリフルオロメトキシ 10 -3-メチルベンジルカルバモイル基、4-メトキシベンジルカルバモイル基、 2-エトキシベンジルカルバモイル基、3-エトキシベンジルカルバモイル基、 4-エトキシベンジルカルバモイル基、2-イソプロポキシベンジルカルバモイ ル基、3-イソプロポキシベンジルカルバモイル基、4-イソプロポキシベンジ ルカルバモイル基、4-トリフルオロメチルベンジルカルバモイル基、4ーペン 15 タフルオロエチルベンジルカルバモイル基、4-n-ヘプタフルオロプロピルベ ンジルカルバモイル基、4ートリフルオロメトキシベンジルカルバモイル基、4 ーペンタフルオロエトキシベンジルカルバモイル基、4-n-ヘプタフルオロプ ロポキシベンジルカルバモイル基等のフェニルC1~6アルキルカルバモイル基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハ 20 ロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が 1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

ピペラジニルカルボニル基(ピペラジン環上には、C1~6アルコキシカルボニル基、フェニルC1~6アルコキシカルボニル基 [フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい]及びフェニルC1~6アルキル基 [フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい]からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、1ーピペラジニルカルボニル基、2ーピペラジニルカルボニル基、3ーピペラジ

ニルカルボニル基、4ーピペラジニルカルボニル基、4-tert-ブトキシカ ルボニルー1ーピペラジニルカルボニル基、4ー(4ーメチルベンジルオキシカ ルボニル) -1-ピペラジニルカルボニル基、4-(2,4-ジメチルベンジル オキシカルボニル) -1-ピペラジニルカルボニル基、4-(2,4,6-トリ メチルベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニルカルボニル基、4-(4 ートリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル) -1-ピペラジニルカルボニ ル基、4-(4-メチルベンジル)-1-ピペラジニルカルボニル基、4-(3, 4-ジメチルベンジル)-1-ピペラジニルカルボニル基、4-(3,4,5-トリメチルベンジル) -1-ピペラジニルカルボニル基、4-(4-トリフルオ ロメチルベンジル) -1-ピペラジニルカルボニル基、4-メトキシカルボニル 10 -3-ベンジル-1-ピペラジニルカルボニル基、4-ベンジルオキシカルボニ ルー3,5-ジメトキシカルボニルー1-ピペラジニルカルボニル基等のピペラ ジニルカルボニル基(ピペラジン環上には、C1~6アルコキシカルボニル基、 フェニル環上にハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基1~3個を有 することのあるフェニルC1~6アルコキシカルボニル基及びフェニル環上にハ 15 ロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基を1~3個有することのあるフ ェニルC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していても よい。)を挙げることができる。

フェニルC1~6アルコキシ基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン 置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換されていてもよい)とは、上で定義したハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換されていてもよいフ 25 ェニルC1~6アルコキシ基であって、例えば、ベンジルオキシ基、2-フェニルエトキシ基、3-フェニルプロポキシ基、2-フェニルプロポキシ基、4-フェニルプトキシ基、6 ーフェニルヘキシルオキシ基、2-フルオロベンジルオキシ基、3-フルオロベンジルオキシ基、3-フルオロベンジルオキシ基、3-フルオロベンジルオキシ基、2-(2-フルオロスニンジルオキシ基、4-フルオロベンジルオキシ基、2-(2-フルオロスニ

ル) エトキシ基、2-(3-フルオロフェニル) エトキシ基、2-(4-フルオ ロフェニル) エトキシ基、2-クロロベンジルオキシ基、3-クロロベンジルオ キシ基、4-クロロベンジルオキシ基、2-フルオロ-4-ブロモベンジルオキ シ基、4-クロロー3-フルオロベンジルオキシ基、2,3,4-トリクロロベ ンジルオキシ基、3,4,5-トリフルオロベンジルオキシ基、2,3,4,5, 6-ペンタフルオロベンジルオキシ基、2,4,6-トリクロロベンジルオキシ 基、4-イソプロピルベンジルオキシ基、4-n-ブチルベンジルオキシ基、4 -メチルベンジルオキシ基、2-メチルベンジルオキシ基、3-メチルベンジル オキシ基、2,4-ジメチルベンジルオキシ基、2,3-ジメチルベンジルオキ 10 シ基、2,6-ジメチルベンジルオキシ基、3,5-ジメチルベンジルオキシ基、 2, 5-ジメチルベンジルオキシ基、2, 4, 6-トリメチルベンジルオキシ基、 3, 5-ジトリフルオロメチルベンジルオキシ基、4-イソプロポキシベンジル オキシ基、4-n-ブトキシベンジルオキシ基、4-メトキシベンジルオキシ基、 2-メトキシベンジルオキシ基、3-メトキシベンジルオキシ基、2, 4-ジメ トキシベンジルオキシ基、2,3-ジメトキシベンジルオキシ基、2,6-ジメ 15 トキシベンジルオキシ基、3,5-ジメトキシベンジルオキシ基、2,5-ジメ トキシベンジルオキシ基、2,4,6-トリメトキシベンジルオキシ基、3,5 ージトリフルオロメトキシベンジルオキシ基、2ーイソプロポキシベンジルオキ シ基、3-クロロー4-メトキシベンジルオキシ基、2-クロロー4-トリフル オロメトキシベンジルオキシ基、3-メチル-4-フルオロベンジルオキシ基、 4-ブロモ-3-トリフルオロメチルベンジルオキシ基、2-(2-クロロフェ ニル) エトキシ基、2-(3-クロロフェニル) エトキシ基、2-(4-クロロ フェニル) エトキシ基、2-トリフルオロメチルベンジルオキシ基、3-トリフ ルオロメチルベンジルオキシ基、4-トリフルオロメチルベンジルオキシ基、2 - トリフルオロメトキシベンジルオキシ基、3-トリフルオロメトキシベンジル オキシ基、4-トリフルオロメトキシベンジルオキシ基、2-(2-トリフルオ ロメチルフェニル) エトキシ基、2-(3-トリフルオロメチルフェニル) エト キシ基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エトキシ基、2-(2-トリ フルオロメトキシフェニル)エトキシ基、2-(3-トリフルオロメトキシフェ

C3~8シクロアルキルーC1~6アルキル基とは、炭素数3乃至8個の環状 アルキル基と炭素数1乃至6個のアルキル基で構成される基であって、例えば、 シクロプロピルメチル基、2-シクロプロピルエチル基、3-シクロプロピルプ 15 ロピル基、4ーシクロプロピルブチル基、4ーシクロプロピルペンチル基、6-シクロプロピルヘキシル基、シクロブチルメチル基、2-シクロブチルエチル基、 3ーシクロブチルプロピル基、4ーシクロブチルブチル基、4ーシクロブチルペ ンチル基、6-シクロブチルヘキシル基、シクロペンチルメチル基、2-シクロ ペンチルエチル基、3-シクロペンチルプロピル基、4-シクロペンチルブチル 20 基、4-シクロペンチルペンチル基、6-シクロペンチルヘキシル基、シクロヘ キシルメチル基、2-シクロヘキシルエチル基、3-シクロヘキシルプロピル基、 4-シクロヘキシルブチル基、4-シクロヘキシルペンチル基、6-シクロヘキ シルヘキシル基、シクロヘプチルメチル基、2-シクロヘプチルエチル基、3-シクロヘプチルプロピル基、4-シクロヘプチルブチル基、4-シクロヘプチル ペンチル基、6-シクロヘプチルヘキシル基、シクロオクチルメチル基、2-シ 25クロオクチルエチル基、3ーシクロオクチルプロピル基、4ーシクロオクチルブ チル基、4-シクロオクチルペンチル基、6-シクロオクチルヘキシル基等を挙 げることができる。

15

本発明の化合物の製造方法を以下に示す。

「反応工程式-1]

$$R^1$$
 $C(H_2)_n R^2$ $C(H_2)_n R^2$

[式中、 R^1 、 R^2 及びnは前記に同じ。 X_1 はハロゲン原子又はニトロ基を示 10 す。]

反応工程式-1によれば、一般式(1)で表される本発明化合物は、塩基性化合物の存在下又は非存在下に、一般式(2)で表される4-ニトロイミダゾール化合物と一般式(3a)で表されるエポキシ化合物とを反応させて一般式(4a)で表される化合物を得、次いで得られた一般式(4a)で表される化合物を閉環させることにより製造される。

一般式(2)の化合物と一般式(3 a)の化合物との使用割合は、通常前者に対して後者を0.5モル~5倍モル、好ましくは0.5モル~3倍モルとするのがよい。

塩基性化合物としては、公知のものを広く使用でき、例えば金属水素化物、金 20 属アルコラート、水酸化物、炭酸塩、炭酸水素塩等の無機塩基性化合物、酢酸塩 等の有機塩基性化合物等が挙げられる。

金属水素化物としては、具体的には、水素化ナトリウム、水素化カリウム等を例示できる。金属アルコラートとしては、具体的には、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム tertーブトキシド等を例示できる。水酸化25 物としては、具体的には、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等を例示できる。炭酸塩としては、具体的には、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等を例示できる。炭酸水素塩としては、具体的には、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等を例示できる。無機塩基性化合物には、上記以外に、ナトリウムアミド等も包含される。

酢酸塩としては、具体的には、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム等を例示できる。 上記以外の有機塩基性化合物としては、具体的には、トリエチルアミン、トリメ チルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン、ジメチルアニリン、1-メチルピロリジン、N-メチルモルホリン、1,5-ジアザビシクロ〔4.3.

 5 0〕ノネン-5 (DBN)、1、8-ジアザビシクロ〔5.4.0〕ウンデセン -7 (DBU)、1、4-ジアザビシクロ〔2.2.2〕オクタン (DABC
 O) 等を例示できる。

斯かる塩基性化合物は、一般式(2)の化合物に対して、通常 $0.1\sim2$ 倍モル、好ましくは0.1倍~等モル、より好ましくは $0.1\sim0.5$ 倍モル用いるのがよい。

一般式(2)の化合物と一般式(3 a)の化合物との反応は、通常、適当な溶媒中で行われる。

溶媒としては、反応を阻害しない溶媒であれば公知のものを広く使用できる。このような溶媒としては、例えば、ジメチルホルムアミド (DMF)、ジメチル15 スルホキシド (DMSO)、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン系溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラリン、流動パラフィン等の炭化水素系溶媒、メタノール、エタノール、イソプロパノール、nーブタノール、tertーブタノール等のアルコール系溶媒、テトラヒドロフラン (THF)、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエ20 ーテル、ジグライム等のエーテル系溶媒、酢酸エチル、酢酸メチル等のエステル系溶媒、これらの混合溶媒等が挙げられる。これらの溶媒は、水が含まれていてもよい。

- 一般式(2)の化合物と一般式(3 a)の化合物との反応は、例えば、一般式(2)の化合物を反応溶媒に溶解し、撹拌しながら氷冷下乃至は室温(3 0 ℃)
- 25 で塩基性化合物を加え、室温~80℃で30分~1時間撹拌した後、一般式(3 a)の化合物を加え、通常室温~100℃、好ましくは50~80℃で30分~60時間、好ましくは1~50時間、攪拌を続けることにより行われる。

原料として用いられる化合物(2)は公知化合物である。化合物(3 a)は、 新規化合物を包含し、該化合物の製造方法については後述する。

斯くして得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の 単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等 の通常の精製操作によって、一般式(4 a)の化合物を反応混合物から単離精製 することができる。

5 一般式(1)で表される本発明化合物は、一般式(4 a)で表される化合物を 閉環反応に供することにより製造される。閉環反応は、上記で得られた一般式 (4 a)で表される化合物を反応溶媒に溶解し、塩基性化合物を加えて撹拌する ことにより行われる。

反応溶媒及び塩基性化合物としては、上記一般式(2)の化合物と一般式(3 10 a)の化合物との反応で用いられる反応溶媒及び塩基性化合物と同じものを使用 できる。

塩基性化合物の使用量は、一般式(4a)の化合物に対して、通常等モル〜過剰モル、好ましくは $1\sim5$ 倍モル、より好ましくは $1\sim2$ 倍モルである。

閉環反応の反応温度は、通常 0 ~ 1 5 0 ℃、好ましくは室温~ 1 2 0 ℃、より 15 好ましくは 5 0 ~ 1 0 0 ℃である。反応時間は、通常 3 0 分~ 4 8 時間、好まし くは 1 ~ 2 4 時間、より好ましくは 1 ~ 1 2 時間である。

斯くして得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の 単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等 の通常の精製操作によって、一般式(1)の化合物を反応混合物から単離精製す ることができる。

本発明では、一般式(2)の化合物と一般式(3 a)の化合物との反応により生成する一般式(4 a)の化合物を単離することなく、反応混合物をそのまま引き続く閉環反応に供することができる。例えば、一般式(2)の化合物と一般式(3 a)の化合物とを室温~80℃で反応させた後、反応混合物に塩基性化合物を添加し、50~100℃で更に攪拌を行うか、又は一般式(2)の化合物と一般式(3 a)の化合物とを室温~80℃で反応させた後、反応混合物を濃縮し、残留物を高沸点溶媒に溶解し、得られる溶液に塩基性化合物を添加し、50~100℃で更に攪拌を行うことにより、一般式(1 a)で表される目的化合物を製造することもできる。

また、一般式(2)の化合物と一般式(3 a)の化合物との反応において、塩 基性化合物を化合物(2)に対して0.9~2倍モル用い、50~100℃で攪 拌することにより、一般式(2)の化合物と一般式(3 a)の化合物との反応を 一挙に行い、一般式(1 a)で表される目的化合物を製造することもできる。

5 [反応工程式-2]

10

15

20

[式中、 R^1 及び X_1 は前記に同じ。 R^{2a} は、一般式(A)、(B)、(E) 又は(F)で表される基を示す。]

反応工程式-2によれば、一般式(1b)で表される本発明化合物は、塩基性化合物の存在下に、一般式(3b)で表される化合物と一般式(5)で表される化合物又はその塩とを反応させて一般式(4b)で表される化合物を得、次いで得られた一般式(4b)で表される化合物を閉環させることにより製造される。

化合物(3b)は新規化合物であり、該化合物の製造方法については後述する (反応工程式-13)。また、R^{2a}が一般式(E)で表される基を示す化合物 (5)は新規化合物を包含しており、該化合物の製造方法の一例を後記参考例1 82、参考例186~参考例188及び参考例192に示す。

一般式(3b)の化合物と一般式(5)の化合物との使用割合は、通常前者に対して後者を0.5モル~5倍モル、好ましくは0.5モル~2倍モルとするのがよい。

一般式(3b)の化合物と一般式(5)の化合物との反応は、塩基性化合物の 25 存在下、適当な溶媒中で行われる。

塩基性化合物及び反応溶媒としては、上記一般式(2)の化合物と一般式(3 a)の化合物との反応で用いられる塩基性化合物及び反応溶媒と同じものを使用できる。塩基性化合物の使用量は、一般式(3 b)の化合物に対して、通常触媒量、好ましくは0.1倍~3モル、より好ましくは0.1~2倍モルである。

 R^{2a} が一般式 (B) 又は (E) で表される基を示す化合物 (5) の場合、化合物 (5) と塩基性化合物とを用いる代わりに、該化合物 (5) の塩を使用することができる。斯かる塩としては、化合物 (5) のナトリウム塩、カリウム塩等のアルカリ金属塩が挙げられる。

5 一般式 (3b) の化合物と一般式 (5) の化合物との反応は、通常室温~15 0℃、好ましくは室温~120℃、より好ましくは室温~80℃で行われる。反応時間は、通常10分~48時間、好ましくは10分~24時間、より好ましくは10分~2時間である。

斯くして得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の 10 単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等 の通常の精製操作によって、一般式(4b)の化合物を反応混合物から単離精製 することができる。

一般式(1b)で表される本発明化合物は、一般式(4b)で表される化合物を閉環反応に供することにより製造される。閉環反応は、上記で得られた一般式(4b)で表される化合物を反応溶媒に溶解し、塩基性化合物を加え、所定の温度にて撹拌することにより行われる。

反応溶媒及び塩基性化合物としては、上記一般式(3b)の化合物と一般式(5)の化合物との反応で用いられる反応溶媒及び塩基性化合物と同じものを使用できる。

20 塩基性化合物の使用量は、一般式(4b)の化合物に対して、通常等モル〜過剰モル、好ましくは等モル〜5倍モル、より好ましくは等モル〜2倍モルである。 閉環反応の反応温度は、通常0〜150℃、好ましくは室温〜120℃、より好ましくは50〜100℃である。反応時間は、通常10分〜48時間、好ましくは10分〜24時間、より好ましくは20分〜4時間である。

25 斯くして得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の 単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等 の通常の精製操作によって、一般式(1b)の化合物を反応混合物から単離精製 することができる。

本発明では、一般式 (3b) の化合物と一般式 (5) の化合物との反応により

生成する一般式(4b)の化合物を単離することなく、反応混合物をそのまま引き続く閉環反応に供することができ、斯くして目的とする一般式(1b)で表される本発明化合物を製造することもできる。

特に、 R^{2a} が一般式 (B) 又は (E) で表される基を示す化合物 (5) の場合、塩基性化合物を化合物 (5) に対して等モル〜過剰モル使用し、 $50\sim10$ 0 \mathbb{C} で反応を行えば、中間体 (4) が単離されずに、一般式 (1b) の本発明化合物が一挙に製造される。 R^{2a} が一般式 (B) 又は (E) で表される基を示す化合物 (5) のアルカリ金属塩(例えば、ナトリウム塩、カリウム塩)を用いた場合も同様である。

10 [反応工程式-3]

15

[式中、R ⁴¹ 及びX₁ は前記に同じ。]

反応工程式-3によれば、一般式(1 c)で表される本発明化合物は、塩基性化合物の存在下に、一般式(2)で表される化合物と一般式(3 c)で表される化合物とを反応させて一般式(4 c)で表される化合物を得、次いで得られた一般式(4 c)で表される化合物を閉環させることにより製造される。

化合物(3 c)は新規化合物を包含しており、該化合物の製造方法については 後述する(反応工程式-14)。

一般式(2)の化合物と一般式(3 c)の化合物との使用割合は、通常後者に対して前者を0.1~2倍モル、好ましくは0.1倍~等モル、より好ましくは25 0.1~0.5倍モルとするのがよい。

一般式(2)の化合物と一般式(3 c)の化合物との反応は、塩基性化合物の存在下、適当な溶媒中で行われる。

塩基性化合物及び反応溶媒としては、上記一般式(2)の化合物と一般式(3 a)の化合物との反応で用いられる塩基性化合物及び反応溶媒と同じものを使用

できる。塩基性化合物の使用量は、一般式(2)の化合物に対して、通常0.1倍モル〜過剰モル、好ましくは $1\sim5$ 倍モル、より好ましくは $1\sim2$ 倍モルである。

- 一般式(2)の化合物と一般式(3 c)の化合物との反応は、例えば、一般式 (2)の化合物を反応溶媒に溶解し、撹拌しながら氷冷下乃至は室温(30℃)で塩基性化合物を加え、室温~80℃で30分~1時間撹拌した後、一般式(3 c)の化合物を加え、通常室温~100℃、好ましくは50~80℃で30分~24時間、好ましくは1~12時間、より好ましくは1~8時間攪拌を続けることにより行われる。
- 10 斯くして得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の 単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等 の通常の精製操作によって、一般式(4 c)の化合物を反応混合物から単離精製 することができる。
- 一般式(1 c)で表される本発明化合物は、一般式(4 c)で表される化合物 15 を閉環反応に供することにより製造される。閉環反応は、上記で得られた一般式 (4 c)で表される化合物を反応溶媒に溶解し、塩基性化合物を加え、所定の温度にて撹拌することにより行われる。

反応溶媒及び塩基性化合物としては、上記一般式(2)の化合物と一般式(3 c)の化合物との反応で用いられる反応溶媒及び塩基性化合物と同じものを使用 20 できる。

塩基性化合物の使用量は、一般式(4c)の化合物に対して、通常等モル〜過剰モル、好ましくは $1\sim5$ 倍モル、より好ましくは $1\sim2$ 倍モルである。

斯くして得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の 単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等 の通常の精製操作によって、一般式(1 c)の化合物を反応混合物から単離精製 することができる。 本発明では、一般式(2)の化合物と一般式(3 c)の化合物との反応により生成する一般式(4 c)の化合物を単離することなく、反応混合物をそのまま引き続く閉環反応に供することができ、斯くして目的とする一般式(1 c)で表される本発明化合物を製造することもできる。

5 [反応工程式-4]

[式中、 R^1 及びnは前記に同じ。 R^{3a} は $C1\sim6$ アルコキシー $C1\sim6$ アルキル基を示す。 R^{3b} は $C1\sim6$ アルカノイル基を示す。

15 一般式(1) において、R²が一般式(A) で表される基を示し、R³が A1)の水素原子を示す化合物(以下「化合物(1-A-A1)」という)は、対応 するR³が A3)のC1~6アルコキシーC1~6アルキル基を示す化合物(以下「化合物(1-A-A3)」という)又はR³が A9)のC1~6アルカノイル 基を示す化合物(以下「化合物(1-A-A9)」という)を加水分解することに 20 より製造される。

化合物(1-A-A3)の加水分解は、酸性条件下で行われる。例えば、化合物(1-A-A3)を適当な溶媒に懸濁又は溶解した液に、酸を加え、0~120℃で撹拌することにより行われる。使用される溶媒は、例えば、水、メタノール、エタノール、イソプロパノール、エチレングリコール等のアルコール系溶媒、アセトニトリル、アセトン、トルエン、DMF、DMSO、酢酸、トリフルオロ酢酸、これらの混合溶媒等を挙げることができる。使用される酸は、例えばトリフルオロ酢酸、酢酸等の有機酸、塩酸、臭素酸、臭化水素酸、硫酸等の無機酸等を挙げることができる。トリフルオロ酢酸、酢酸等の有機酸は、それ自身反応溶媒としても使用できる。反応温度は、通常0~120℃、好ましくは室温~100

 \mathbb{C} 、より好ましくは室温~80 \mathbb{C} である。反応時間は、通常30分~24時間、好ましくは30分~12時間、より好ましくは1~8時間である。

化合物(1-A-A9)の加水分解は、塩基性条件下で行われる。例えば、化合物(1-A-A9)を適当な溶媒に懸濁又は溶解した液に、塩基を加え、0~12 0℃で撹拌することにより行われる。使用される溶媒は、例えば、水、メタノール、エタノール、イソプロパノール、エチレングリコール等のアルコール系溶媒、又はこれらの混合溶媒である。使用される塩基は、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸化物、酢酸ナトリウム等の酢酸塩等を挙げることができる。反10 応温度は、0~120℃、好ましくは室温~100℃、より好ましくは室温~80℃である。反応時間は、30分~24時間、好ましくは30分~12時間、より好ましくは1~8時間である。

斯くして得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の 単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等 の通常の精製操作によって、化合物(1-A-A1)を反応混合物から単離精製す ることができる。

[反応工程式-5]

20
$$R^{1}$$
 $(CH_{2})_{n}OH$
 $R^{3aa}SO_{2}X_{2}$
 $O_{2}N$
 $(1-A-A1)$
 R^{1}
 $(CH_{2})_{n}OSO_{2}R^{3aa}$
 $(1-A-A7)$

[式中、 R^1 及びnは前記に同じ。 X_2 はハロゲン原子を示す。 R^{3aa} は C_{1-6} アルキル基又は、 C_{1-6} アルキル基が置換していてもよいフェニル基を示す。]

25 一般式 (1) において、 R^2 が一般式 (A) で表される基を示し、 R^3 が A7)又は A8) のスルホニル基を示す化合物(以下「化合物(1-A-A7)」という)は、対応する R^3 が A1)の水素原子を示す化合物(化合物(1-A-A1))をスルホニル化することにより製造される。

化合物(1-A-AI)のスルホニルには、一般に行われているアルコールのス

ルホニル化反応の反応条件を広く適用できる。例えば、化合物 (1-A-A1) を 適当な溶媒に溶解し、この溶液に塩基性化合物の存在下、一般式

R 3 a 3 S O $_{2}$ X $_{2}$ で表される化合物を加え、 $0\sim150$ で撹拌することによって化合物(1-A-A7)を得ることができる。

5 使用される溶媒としては、スルホニル化反応を阻害しない溶媒であれば全て使用できる。このような溶媒としては、例えば、塩化メチレン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素系溶媒、DMF、DMSO、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素系溶媒、テトラリン、流動パラフィン、シクロヘキサン等の炭化水素系溶媒、THF、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジグライム等のエーテル系溶媒、酢酸エチル、アセトン等、又はこれらの混合溶媒等が挙げられる。

一般式 R^{3aa} SO_2X_2 で表される化合物は、化合物(1-A-A1)に対して、通常等モル〜過剰モル、好ましくは等モル〜2倍モル、より好ましくは等モル〜1.1倍モル使用すればよい。

15 塩基性化合物としては、上記一般式(2)の化合物と一般式(3 a)の化合物との反応で用いられる塩基性化合物と同じものを使用できる。

塩基性化合物の使用量は、一般式 \mathbf{R}^{3} a a $\mathbf{SO}_2\mathbf{X}_2$ で表される化合物に対して、通常等モル〜過剰モル、好ましくは $\mathbf{1}\sim \mathbf{5}$ 倍モル、より好ましくは $\mathbf{1}\sim \mathbf{2}$ 倍モルである。

20 本スルホニル化反応では、4-ジメチルアミノピリジン、4-(1-ピロリジ ニル)ピリジン等を触媒として使用することもできる。

25 斯くして得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の 単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等 の通常の精製操作によって、化合物 (1-A-A7) を反応混合物から単離精製す ることができる。

[反応工程式-6]

[式中、R¹、R^{2a}、R^{3aa}及びnは前記に同じ。]

一般式(1)において、 R^2 が一般式(A),(B)、(E)又は(F)で表される基を示す化合物(以下「化合物(1 b)」という)は、 R^2 が一般式

(A) で表される基を示し、対応するR 3 がA7)の又はA8) スルホニル基を示す 10 化合物(化合物(1-A-A7)と一般式(5)で表される化合物とを反応させることによっても製造される。

化合物(1-A-A7)と一般式(5)で表される化合物との反応は、適当な溶媒中、塩基性化合物の存在下で行われる。

使用される溶媒としては、本反応を阻害しない溶媒であれば全て使用できる。

15 このような溶媒としては、例えば、水、DMF、DMSO, アセトニトリル等の
非プロトン性極性溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラリン、流動パラ
フィン、シクロヘキサン等の炭化水素系溶媒、エタノール、イソプロパノール、
ローブタノール、tertーブタノール等のアルコール系溶媒、THF, ジオキ
サン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジグライム等のエーテル系溶媒、
20 酢酸エチル、アセトン等、又はこれらの混合溶媒等が挙げられる。

塩基性化合物としては、上記一般式(2)の化合物と一般式(3 a)の化合物との反応で用いられる塩基性化合物と同じものを使用できる。

塩基性化合物の使用量は、化合物(1-A-A7)に対して、通常等モル〜過剰 モル、好ましくは1~5倍モル、より好ましくは1~2倍モルである。

25 一般式 (5) で表される化合物は、化合物 (1-A-A7) 又は (1-A-A8) に対して、通常等モル〜過剰モル、好ましくは $0.9 \sim 2$ 倍モル、より好ましくは $0.9 \sim 1.5$ 倍モル使用すればよい。

反応温度は、通常室温 \sim 150 $^{\circ}$ 、好ましくは室温 \sim 100 $^{\circ}$ 、より好ましくは60 \sim 100 $^{\circ}$ である。反応時間は、通常10分 \sim 24時間、好ましくは10

分~12時間、より好ましくは20分~7時間である。

斯くして得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の 単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等 の通常の精製操作によって、目的化合物を反応混合物から単離精製することがで きる。

「反応工程式-7]

5

10

20

$$R^1$$
 $C(CH_2)_{n}OH$
 $DNNX-FIL$
 O_{2N}
 N
 O_{2N}
 N
 $O(CH_2)_{n}OCONR^7R^8$
 O_{2N}
 $O(1-A-A1)$

[式中、R¹、n、R⁷及びR⁸は前記に同じ。]

一般式 (1) において、 R^2 が一般式 (D) で表される基を示す化合物(以下「化合物 (1-D)」という)は、 R^2 が一般式 (A) で表される基を示し、

15 R^3 が A1)の水素原子を示す化合物(化合物(1-A-A1))をカルバメート 化することにより製造される。

化合物(1-A-A1)のカルバメート化には、一般に行われているアルコールのカルバメート化反応の反応条件を広く適用できる。このような方法としては、例えば、①一般式 R^7R^8 NH(式中、 R^7 及び R^8 は前記に同じ)で表されるアミン及びトリホスゲンを用いる方法、②一般式 R^7R^8 NH(式中、 R^7 及び R^8 は前記に同じ)で表されるアミン及びカルボジイミダゾールを用いる反応、③イソシアナート化合物を用いる方法等が挙げられる。

① アミン及びトリホスゲンを用いる方法:

一般式 R^7R^8NH (式中、 R^7 及び R^8 は前記に同じ)で表されるアミン 25 にトリホスゲンを作用させると、一般式 $C1CONR^7R^8$ (式中、 R^7 及び R^8 は前記に同じ)で表されるカルバミン酸クロライドが生成する。カルバミン酸クロライドは、単離してもよいが、一般的に不安定であるため、単離すること なくそのまま次の工程で使用する。

トリホスゲンの塩化メチレン溶液に冷却撹拌下、塩基性化合物及び上記アミン

を加え、0~30℃で30分~4時間撹拌してカルバミン酸クロライドを発生させる。トリホスゲンの使用量は、アミンに対して、通常0.3~1.5倍モル、好ましくは0.3~0.6倍モル、より好ましくは0.3~0.4倍モルである。アミンとトリホスゲンとの反応において使用される塩基性化合物としては、例えば、トリエチルアミン、Nーエチルジイソプロピルアミン、Nーメチルモルホリン等が挙げられる。これらの塩基性化合物は、トリホスゲンに対して、通常3倍モル~過剰モル、好ましくは3~4.5倍モル、より好ましくは3~3.3倍モル用いる。

反応温度は、通常 0 ~ 6 0 ℃、好ましくは 0 ℃ ~ 室温 (3 0 ℃) であり、反応 10 時間は、通常 3 0 分 ~ 8 時間、好ましくは 1 ~ 4 時間、より好ましくは 1 ~ 2 時間である。

斯くして得られるカルバミン酸クロライドの反応溶液は、そのまま使用できるが、不溶物を濾過して除き、濾液を濃縮した方がより有利である。

次に、化合物(1-A-A1)を適当な反応溶媒に溶解し、上記で製造したカル 15 バミン酸クロライドを氷冷撹拌下加え、次いで塩化第一銅を加えた後、更に所定 温度で所定時間撹拌することによって、化合物(1-D)を製造することができ る。

ここで使用できる反応溶媒は、反応を阻害しない溶媒を広く使用できる。このような溶媒としては、例えば、DMF、DMSO、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラリン、流動パラフィン等の炭化水素系溶媒、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素系溶媒、THF、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジグライム等のエーテル系溶媒、アセトン、酢酸エチル又は上記混合溶媒等を挙げることができる。

25 カルバミン酸クロライドは、化合物(1-A-A1)に対して、通常等モル~5 倍モル、好ましくは等モル~3倍モル、より好ましくは等モル~2倍モル使用するのがよい。

また、塩化第一銅は、化合物(1-A-A1)に対して、通常 $0.1\sim5$ 倍モル、 好ましくは $0.5\sim2$ 倍モル、より好ましくは0.5倍モル〜等モル使用すれば よい。

15

20

反応温度は、通常 $0\sim60$ \mathbb{C} 、好ましくは $10\sim50$ \mathbb{C} 、より好ましくは $20\sim35$ \mathbb{C} である。反応時間は、通常30 分 ~48 時間、好ましくは $1\sim30$ 時間、より好ましくは $2\sim24$ 時間である。

5 ②アミン及びカルボジイミダゾールを用いる反応:

一般式 $R^7 R^8 NH$ (式中、 $R^7 及 UR^8$ は前記に同じ) で表されるアミンを適当な反応溶媒に溶解し、これに氷冷攪拌下、1, 1'-カルボニルジイミダゾールを加え、所定温度で所定時間攪拌することにより、アミノカルボニルイミダゾール誘導体が得られる。

10 1, 1'-カルボニルジイミダゾールの使用量は、アミンに対して、通常 0. $9 \sim 2$ 倍モル、好ましくは等モル ~ 1 . 5 倍モル、より好ましくは等モル ~ 1 . 2 倍モルである。

使用される溶媒は、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラリン、流動パラフィン等の炭化水素系溶媒、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素系溶媒、THF、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジグライム等のエーテル系溶媒、アセトン、酢酸エチル又は上記混合溶媒等を挙げることができる。

反応温度は、通常 $0\sim60$ \mathbb{C} 、好ましくは0 \mathbb{C} \mathbb{C} 室温(30 \mathbb{C})であり、反応時間は、通常30 \mathbb{C} \mathbb{C} の 時間、好ましくは $1\sim4$ 時間、より好ましくは $1\sim2$ 時間である。

次に、予め化合物(1-A-A1)を適当な溶媒に溶解し、これに上記で得られるアミノカルボニルイミダゾール誘導体を氷冷攪拌下に加え、更に塩化第一銅を加えて所定温度で所定時間攪拌することにより、化合物(1-D)を製造することができる。

25 ここで使用できる反応溶媒は、反応を阻害しない溶媒を広く使用できる。このような溶媒としては、例えば、DMF、DMSO、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラリン、流動パラフィン等の炭化水素系溶媒、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素系溶媒、THF、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテ

ル、ジグライム等のエーテル系溶媒、アセトン、酢酸エチル又は上記混合溶媒等 を挙げることができる。

アミノカルボニルイミダゾール誘導体は、化合物(1-A-A1)に対して、通常等モル~5倍モル、好ましくは等モル~3倍モル、より好ましくは等モル~2 5 倍モル使用するのがよい。

また、塩化第一銅は、化合物(1-A-AI)に対して、通常 $0.9\sim5$ 倍モル、好ましくは等モル ~2 倍モル、より好ましくは等モル ~1.2 倍モル使用すればよい。

反応温度は、通常0~60℃、好ましくは10~50℃、より好ましくは20 10 ~35℃である。反応時間は、通常30分~48時間、好ましくは1~30時間、 より好ましくは1~3時間である。

③イソシアナートを用いる方法:

化合物(1-A-A1)を適当な反応溶媒に溶解し、これに氷冷攪拌下、イソシアネート類を加え、更に塩化第一銅を加えて、所定温度で所定時間攪拌することにより、 R^7 又は R^8 が水素原子を示す化合物(1-D)を製造することができる。

ここで使用できる反応溶媒は、反応を阻害しない溶媒を広く使用できる。このような溶媒としては、例えば、DMF、DMSO、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラリン、流動パラフィン等20 の炭化水素系溶媒、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素系溶媒、THF、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジグライム等のエーテル系溶媒、アセトン、酢酸エチル又は上記混合溶媒等を挙げることができる。

イソシアナート類は、化合物(1-A-A1)に対して、通常等モル~5倍モル、 25 好ましくは等モル~3倍モル、より好ましくは等モル~2倍モル使用するのがよい。

また、塩化第一銅は、化合物(1-A-A1)に対して、通常 $0.9\sim5$ 倍モル、 好ましくは等モル ~2 倍モル、より好ましくは等モル ~1.2 倍モル使用すれば よい。

反応温度は、通常 $0\sim60$ \mathbb{C} 、好ましくは $10\sim50$ \mathbb{C} 、より好ましくは $20\sim35$ \mathbb{C} である。反応時間は、通常30 \mathbb{C} 0 \mathbb{C} 0 時間、好ましくは $1\sim30$ 時間、より好ましくは $1\sim3$ 時間である。

上記①、②又は③の方法で得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、 濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、化合物(1-D)を反応混合物から 単離精製することができる。

一般式(1)の本発明化合物において、分子内に窒素原子を含む複素環を有し、 該複素環上の窒素原子にC1~6アルコキシカルボニル基が置換した化合物は、これを脱保護することにより、対応する複素環上の窒素原子に水素原子が置換した 化合物に誘導することができる。

この方法では、例えば、脱保護すべき原料化合物を適当な反応溶媒に溶解し、酸を用いて加水分解することにより、目的化合物を得ることができる。

ここで使用できる反応溶媒は、反応を阻害しない溶媒を広く使用できる。この ような溶媒としては、例えば、水、メタノール、エタノール等のアルコール系溶 媒、DMSO、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラリン、流動パラフィン等の炭化水素系溶媒、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素系溶媒、THF、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジグライム等のエーテル系溶媒、アセトン、酢酸エチル又は上記混合溶媒等を挙げることができる。

酸としては、例えば、塩酸、臭素酸、臭化水素酸等の無機酸、トリフルオロ酢酸、トリクロロ酢酸、酢酸等の有機酸が挙げられ、中でもトリフルオロ酢酸が有利に用いられる。

これらの酸の使用量は、原料化合物に対して、通常等モル以上、好ましくは2 25 ~10倍モルであるが、これらの酸類は反応溶媒として大過剰に用いてもよい。 反応温度は、通常室温~100℃であるが、用いる酸の種類によって適宜調節すればよい。トリフルオロ酢酸を用いる場合には、室温で充分である。反応時間は、通常1~24時間、好ましくは1~12時間である。

斯くして得られた反応混合物を濃縮し、必要なら塩酸等の酸を加えて結晶化し、

15

再結晶等で塩酸塩又はトリフルオロ酢酸塩の形態の目的化合物を単離することができる。

脱保護された目的化合物は、上記のようにして単離することも可能であるが、 単離することなく、トリエチルアミン等の塩基性化合物を加えて遊離形態の目的 化合物に導き、これを次の反応に使用することができる。

例えば、遊離形態の上記目的化合物に酸ハライド、酸無水物又は混合酸無水物を作用させることによって対応するアミド又はカルバメートを製造できる。遊離形態の上記目的化合物とスルホン酸クロライドとを反応させることにより、対応するスルホン酸アミドを製造できる。遊離形態の上記目的化合物をアミンを用いて尿素化することにより、対応する尿素を製造することができる。更に、アルデヒド類を用いる還元的アミノ化反応、又はアルキルハライドによるアルキル化反応を用いて、上記目的化合物のNーアルキル化体を製造することができる。

一般式(1)の本発明化合物において、分子内に窒素原子を含む複素環を有し、該複素環上の窒素原子に水素原子が置換した化合物は、これをカルバメート化することにより、対応する複素環上の窒素原子に $-COOR^{27}$ 基(R^{27} は前記に同じ)が置換した化合物に誘導することができる。

カルバメート化方法としては、例えば、①各種のハロゲン化ぎ酸エステルを用いる方法、②アルコールにカルボニルジイミダゾールを作用させて得られる活性中間体を用いる方法等が挙げられる。

20 ①ハロゲン化ギ酸エステルを用いる方法:

原料化合物を、反応溶媒中、塩基性化合物の存在下に、ハロゲン化ギ酸エステルを反応させることにより、目的化合物を製造できる。

ここで使用できる反応溶媒は、反応を阻害しない溶媒を広く使用できる。このような溶媒としては、例えば、DMSO、アセトニトリル等の非プロトン性極性 25 溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラリン、流動パラフィン等の炭化水素系溶媒、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素系溶媒、THF、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジグライム等のエーテル系溶媒、アセトン、酢酸エチル又は上記混合溶媒等を挙げることができる。

塩基性化合物としては、公知のものを広く使用でき、例えば、水酸化物、炭酸塩、炭酸水素塩等の無機塩基性化合物、酢酸塩等の有機塩基性化合物等が挙げられる。

水酸化物としては、具体的には、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化 セシウム、水酸化リチウム等を例示できる。炭酸塩としては、具体的には、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、炭酸リチウム等を例示できる。炭酸水素塩としては、具体的には、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム、炭酸水素セシウム、炭酸水素リチウム等を例示できる。

酢酸塩としては、具体的には、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム等を例示できる。 10 上記以外の有機塩基性化合物としては、具体的には、トリエチルアミン、トリメチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン、ジメチルアニリン、1ーメチルピロリジン、Nーメチルモルホリン、DBN、DBU、DABCO等を例示できる。

斯かる塩基性化合物は、原料化合物に対して、通常等モル〜4倍モル、好まし15 くは1 \sim 1 . 5 倍モル、より好ましくは1 \sim 1 . 1 倍モル用いるのがよい。

ハロゲン化ぎ酸エステルは、原料化合物に対して、通常等モル〜過剰モル、好ましくは等モル〜1.5倍モル、より好ましくは等モル〜1.1倍モル使用するのがよい。

反応温度は、通常0~100℃、好ましくは0~60℃、より好ましくは10 20 ~30℃である。反応時間は、通常30分~12時間、好ましくは1~6時間、 より好ましくは1~2時間である。

②活性中間体を用いる方法:

適当な溶媒中、一般式 $R^{27}OH(R^{27}$ は前記に同じ)で表されるアルコール 2^{27} と1, 1'-カルボニルジイミダゾールとを反応させて活性中間体を得(第一工 程)、次いで得られる活性中間体に原料化合物を反応させる(第二工程)ことに より、目的化合物を製造できる。

ここで使用できる反応溶媒は、反応を阻害しない溶媒を広く使用できる。このような溶媒としては、例えば、DMF、DMSO、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラリン、流動パラフィン等

の炭化水素系溶媒、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン等のハロゲン 化炭化水素系溶媒、THF、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテ ル、ジグライム等のエーテル系溶媒、アセトン、酢酸エチル又は上記混合溶媒等 を挙げることができる。

5 1, 1'-カルボニルジイミダゾールは、上記一般式で表されるアルコールに 対して、通常等モル〜過剰モル、好ましくは等モル〜1.5倍モル、より好まし くは等モル〜1.1倍モル使用するのがよい。

第一工程の反応温度は、通常 $0\sim100$ $\mathbb C$ 、好ましくは $0\sim60$ $\mathbb C$ 、より好ましくは $10\sim30$ $\mathbb C$ である。また、反応時間は、通常30 $\mathcal C$ $\mathbb C$ ついましくは $1\sim6$ 時間、より好ましくは $1\sim2$ 時間である。

活性中間体は、原料化合物に対して、通常等モル〜過剰モル、好ましくは等モル \sim 1. 5 倍モル、より好ましくは等モル \sim 1. 1 倍モル使用するのがよい。

第二工程の反応温度は、通常 $0\sim100$ \mathbb{C} 、好ましくは $0\sim60$ \mathbb{C} 、より好ましくは $10\sim30$ \mathbb{C} である。また、反応時間は、通常30 \mathbb{C} \mathbb{C} ついましたは $1\sim6$ 時間、より好ましくは $1\sim2$ 時間である。

上記①又は②の方法で得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、カルバメート化された目的化合物を反応混合物から単離精製することができる。

20 一般式 (1) の本発明化合物において、分子内に窒素原子を含む複素環を有し、該複素環上の窒素原子に $R^{32}R^{33}NCO-(R^{32}$ 及び R^{33} は前記に同じ)基が置換した化合物は、対応する複素環上の窒素原子に水素原子が置換した化合物を尿素化することにより製造される。

この尿素化反応には、例えば、①一般式 $R^{32}R^{33}NH$ (式中、 R^{32} 及び 25 R^{33} は前記に同じ)で表されるアミン及びトリホスゲンを用いる方法、②一般 式 $R^{32}R^{33}NH$ (式中、 R^{32} 及び R^{33} は前記に同じ)で表されるアミン及 びカルボニルジイミダゾールを用いる反応、③イソシアナート化合物を用いる方 法等を適用できる。

これら①、②及び③の反応は、例えば、上記化合物 (1-A-A1) のカルバメ

ート化で述べた①、②及び③の反応と同様の反応条件下で行われる。

上記①、②又は③の方法で得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、 濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、目的化合物を反応混合物から単離精 製することができる。

一般式(1)の本発明化合物において、分子内に窒素原子を含む複素環を有し、 該複素環上の窒素原子に R^{38a} ー (R^{38a} は、 $C1\sim6$ アルカノイル基、フェ ニルC2-6アルカノイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換 もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~ 6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよ 10 い)、フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェノキシC2~C6 アルカノイル基、フェニル環上にハロゲンが置換していてもよいフェニルチオC 2~C6アルカノイル基、ベンゾイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハ ロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換 のC1~6アルコキシ基及びC1~6アルキルアミノ基からなる群より選ばれた 15 基の少なくとも1種が置換していてもよい)、4ービフェニリルカルボニル基、 ピリジルカルボニル基又はフェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフ ェニルC2-C6アルケニルカルボニル基を示す)基が置換した化合物は、対応 する複素環上の窒素原子に水素原子が置換した化合物に、一般式R^{38a}OH (R^{38a}は前記に同じ。)で表されるカルボン酸を反応させることにより製造 20 される。

この反応は後記反応式-19の化合物(Ea-2)と化合物(18)の反応と同様の条件下に行なわれることができる。

上記の方法で得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出 25 等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結 晶等の通常の精製操作によって、目的化合物を反応混合物から単離精製すること ができる。

一般式 (1) の本発明化合物において、分子内に窒素原子を含む複素環を有し、 該複素環上の窒素原子に R 39a S O $_2$ - (R 39a はハロゲン原子及び C $_1$ ~ 6

アルキル基なる群から選ばれる基が少なくとも1種置換してもよいフェニル基を示す)基が置換した化合物は、対応する複素環上の窒素原子に水素原子が置換した化合物に、一般式 ${\bf R}^{39a}$ SO $_2$ X $_2$ (${\bf R}^{39a}$ 及び ${\bf X}_2$ は前記に同じ)で表されるスルホン酸ハライドを反応させることにより製造される。

5 該反応は後記反応式-18の化合物(Ed-1)と化合物(15)の反応と同様の条件下に行なわれることができる。

上記の方法で得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、目的化合物を反応混合物から単離精製することができる。

一般式(1)の本発明化合物において、分子内に窒素原子を含む複素環を有し、 該複素環上の窒素原子に R^{40a} (R^{52}) CH- (R^{52} は後記と同じ。 R^{40a} は、フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換も しくは未置換のC1~6アルキル基、シクロヘキシル基、置換基としてC1~C 6アルキル基を有していてもよいアミノ基、C1~6アルコキシカルボニル基、 15 フェノキシ基、フェニルC1~6アルキル基、フェニルC2~6アルケニル基、 ピリジル基、イミダブリル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキ シ基及びピペリジニル基からなる群より選ばれた少なくとも1種が置換していて もよい)、4-ビフェニリル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、 ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置 20 換のC1~6アルコキシ基及び置換基としてC1~6アルキル基を有してもよい アミノ基からなる群より選ばれた少なくとも1種が置換していてもよい)、ナフ チル基、フリル基又はチエニル基を示す。) 基が置換した化合物は、対応する複 素環上の窒素原子に水素原子が置換した化合物を、還元的アルキル化反応に付す 25 ことにより製造される。

この還元的アルキル化反応は、例えば、適当な溶媒中、還元剤の存在下、原料 化合物に、一般式

$$R^{40a} - C = O$$

 $(R^{40a}$ は前記に同じ。 R^{52} は水素原子又は $C1\sim6$ アルキル基を示す。)で表されるアルデヒド又はケトンを反応させることにより行われる。

5 該反応は、後記反応式-16の化合物 (E-2) と化合物 (13) の反応と同様の条件下に行なわれることができる。

上記の方法で得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、目的化合物を反応混合物から単離精製することができる。

[反応工程式-8]

5
$$0_{2}N \qquad N \qquad N - C00R^{42a}$$

$$R^{1} \qquad N - C00R^{42a}$$

$$R^{24a} \qquad R^{24a}$$

$$(1-F-Fc16a) \qquad R^{24a} \qquad R^{24a}$$

$$(1-F-Fc16b) \qquad R^{24a}$$

[式中、 R^1 、 X^2 及びnは前記に同じ。 R^{24} は、(Fca1)~(Fca11)で示される基を示す。 R^{42a} はC1-C6アルキル基を示す。 R^{42} は、(Fca5)、(Fca6)又は(Fca7)で示される基を示す。

 R^{42c} は(Fca2)、(Fca3)、(Fca4)、(Fca8)又は 25 (Fca9)で示される基を示す。 R^{42b} は、フェニル基(フェニル環上には、 少なくとも1個のハロゲン置換もしくは未置換のC1-6アルキル基が置換して いてもよい。)を示す。]

化合物(1-F-Fc16a)を、化合物(1-F-Fc16b)に導く反応は、後記反応式-160の化合物(E-1)を化合物(E-2)に導く反応と同様

の条件下に行なわれることができる。

斯くして得られた反応混合物を濃縮し、必要なら塩酸等の酸を加えて結晶化し、 再結晶等で塩酸塩又はトリフルオロ酢酸塩の形態の目的化合物を単離することが できる。

5 化合物(1-F-Fc16c)は、化合物(1-F-Fc16b)と $R^{42C}X_2$ とを反応させることにより製造される。

該反応は後記反応式-18の化合物(Fd-1)と化合物(15)の反応と同様の条件下に行なわれることができる。

化合物 (1-F-Fc16d) は、化合物 (1-F-Fc16b) と

10 R 42 OHを反応させることにより製造される。

該反応に後記反応式-19の化合物(Ea-2)と化合物(18)の反応と同様の条件下に行なわれることができる。

上記の方法で得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、目的化合物を反応混合物から単離精製することができる。

化合物(1-F-Fc16e)は、化合物(1-F-Fc16b)に、 R $^{42b}-NCO$ を反応させることにより製造される。

該反応は、塩基性化合物の存在下又は非存在下、好ましくは非存在下に適当な 20 不活性溶媒又は無溶媒下で行われる。ここで使用される塩基性化合物は、例えば トリエチルアミン、トリメチルアミン、ピリジン、ジメチルアニリン、Nーエチルジイソプロピルアミン、ジメチルアミノピリジン、Nーメチルモルホリン、1,5-ジアザビシクロ[4.3.0]ノネン-5(DBN)、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデセン-7(DBU)、1,4-ジアザビシクロ[2.

25 2.2] オクタン (DABCO) 等の有機塩基、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の炭酸塩、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム等の金属水酸化物、水素化カリウム、水素化ナトリウム、カリウム、ナトリウム、ナトリウムアミド、ナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート等の金属アルコラート類等の無機塩基等が挙げられる。用いら

れる溶媒としては、具体的にはクロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン、 四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香 族炭化水素類、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラ ン、ジメトキシエタン等のエーテル類、酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸イソプロ ピル等のエステル類、メタノール、エタノール、イソプロパノール、プロパノー ル、ブタノール、3ーメトキシー1-ブタノール、エチルセロソルブ、メチルセ ロソルブ等のアルコール類、アセトニトリル、ピリジン、アセトン、水、N, N ージメチルアセタミド、N, Nージメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、 ヘキサメチル燐酸トリアミド等の非プロトン性極性溶媒又はこれらの混合溶媒等

が挙げられる。 $R^{42b}-NCO$ の使用量としては、化合物(1-F-Fc166) に対して通常等モル~5倍モル量程度、好ましくは等モル~3倍モル量程度 とするのがよい。該反応は通常0~200℃程度、好ましくは室温~150℃程 度付近の温度で、通常5分~30時間程度を要して行われる。該反応には三弗化 硼素ジエチルエーテル錯体等の硼素化合物、塩化第一銅等のハロゲン化銅化合物 等を添加してもよい。
 15

斯くして得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の 単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等 の通常の精製操作によって、目的化合物を反応混合物から単離精製することがで きる。

[反応工程式-9] 20

10

「式中、R^{42a}、R¹及びnは前記に同じ。]

化合物(1-Fdb)は、化合物(1-Fda)を脱保護することにより製造される。具体的には、例えば、化合物(1-Fda)を適当な反応溶媒に溶解し、酸を用いて加水分解することにより、化合物(1-Fdb)を得ることができる。ここで使用できる反応溶媒は、反応を阻害しない溶媒を広く使用できる。このような溶媒としては、例えば、水、メタノール、エタノール等のアルコール系溶媒、DMSO、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラリン、流動パラフィン等の炭化水素系溶媒、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素系溶媒、THF、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジグライム等のエーテル系溶媒、アセトン、酢酸エチル又は上記混合溶媒等を挙げることができる。

酸としては、例えば、塩酸、臭化水素酸、臭素酸等の無機酸、トリフルオロ酢酸、トリクロロ酢酸、酢酸等の有機酸が挙げられ、中でもトリフルオロ酢酸が有利に用いられる。

- 15 これらの酸の使用量は、化合物(1-Fda)に対して、通常等モル以上、好ましくは $2\sim1$ 0倍モルであるが、これらの酸類は反応溶媒として大過剰に用いてもよい。反応温度は、通常室温 ~100 °であるが、用いる酸の種類によって適宜調節すればよい。トリフルオロ酢酸を用いる場合には、室温で充分である。反応時間は、通常 $1\sim24$ 時間、好ましくは $1\sim12$ 時間である。
- 20 斯くして得られた反応混合物を濃縮し、必要なら塩酸等の酸を加えて結晶化し、 再結晶等で塩酸塩又はトリフルオロ酢酸塩の形態の化合物(1-Fdb)を単離 することができる。

[反応工程式-10]

10 [式中、R^{42a}、R¹、n、R³⁴及びR³⁵は前記に同じ。]
 化合物(1-Fdc)は、化合物(1-Fda)に、一般式R³⁴COR³⁵
 (R³⁴及びR³⁵は前記に同じ)で表されるアルデヒド又はケトンを反応させることにより製造される。

この反応は、酸の存在下、適当な溶媒中で行われる。

ここで使用できる反応溶媒は、反応を阻害しない溶媒を広く使用できる。このような溶媒としては、例えば、水、メタノール、エタノール等のアルコール系溶媒、DMSO、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラリン、流動パラフィン等の炭化水素系溶媒、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素系溶媒、THF、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジグライム等のエーテル系溶媒、アセトン、酢酸エチル又は上記混合溶媒等を挙げることができる。

酸としては、例えば、塩酸、臭化水素酸、臭素酸等の無機酸、トリフルオロ酢酸、トリクロロ酢酸、酢酸等の有機酸が挙げられ、中でもトリフルオロ酢酸が有利に用いられる。

25 これらの酸の使用量は、化合物(1-Fda)に対して、通常0.5倍モル以上、好ましくは0.5~1.5倍モルであるが、これらの酸類は反応溶媒として大過剰に用いてもよい。

アルデヒド又はケトンの使用量は、化合物(1-Fda)に対して、通常 0. $9\sim 3$ 倍モル、好ましくは $1\sim 1$. 5 倍モル、より好ましくは $1\sim 1$. 3 倍モル

である。

反応温度は、通常室温~100℃であるが、用いる酸の種類によって適宜調節 すればよい。反応時間は、通常1~12時間、好ましくは1~3時間である。

斯くして得られた反応混合物を濃縮し、必要なら塩酸等の酸を加えて結晶化し、 5 再結晶等で塩酸塩又はトリフルオロ酢酸塩の形態の化合物(1-Fdc)を単離 することができる。

次に、本発明化合物を製造するための出発原料及び中間体の製造方法につき説明する。

[反応工程式-11]

10

[式中、 R^1 、 R^7 、 R^8 、 X_1 及びnは前記に同じ。 R^{3c} は $C1\sim6$ アルコキ シー $C1\sim6$ アルキル基、 $C1\sim6$ アルカノイル基又はpーニトロベンゾイル基を示す。]

化合物(4 d)から化合物(4 e)に導く反応は、例えば、反応工程式-4における化合物(1-A-A3)又は化合物(1-A-A9)から化合物(1-A-A1)に導く反応と同様の反応条件下にて行われる。例えば、R^{3c}がC1~6ア20ルコキシーC1~6アルキル基を示す化合物(4 d)の場合には、化合物(1-A-A3)から化合物(1-A-A1)に導く反応と同様の反応条件下にて行うのがよく、R^{3c}がC1~6アルカノイル基又はp-ニトロベンゾイル基を示す化合物(4 d)の場合には、化合物(1-A-A1)に導く反応と同様の反応条件下にて行うのがよく、R^{3c}がC1~6アルカノイル基又はp-ニトロベンゾイル基を示す化合物(4 d)の場合には、化合物(1-A-A9)から化合物(1-A-A1)に導く反応と同様の反応条件下にて行うのがよい。

25 化合物(4e)から化合物(4f)に導く反応は、例えば、反応工程式-7における化合物(1-A-A1)から化合物(1-D)に導く反応と同様の反応条件下にて行われる。

[反応工程式-12]

$$R^{1}$$
 (CH₂) nOH R^{1} (CH₂) nOSO₂R^{3aa} R^{1} (CH₂) nR^{2a} OH OH OH OH R^{1} (CH₂) nN R^{2} (CH₂) nOSO₂R^{3aa} R^{1} (CH₂) nR^{2a} R^{1} (CH₂) nR^{2a} R^{1} (CH₂) nN R^{2} (CH₂) nOSO₂R^{3aa} R^{1} (CH₂) nR^{2a} R^{1} (CH₂) nOSO₂R^{3aa} R^{1} (CH₂) nR^{2a} R^{1} (CH₂) nOSO₂R^{3aa} R^{1} (CH₂) nOSO₂R^{3aa}

[式中、 R^1 、 R^{2a} 、 R^{3aa} 、 X_1 及びnは前記に同じ。]

化合物(4 e)から化合物(4 g)に導く反応は、例えば、反応工程式-5における化合物(1-A-A1)から化合物(1-A-A7)に導く反応と同様の反応条件下にて行われる。

化合物(4g)から化合物(4h)に導く反応は、例えば、反応工程式-6kだおける化合物(1-A-A7)から化合物(1b)に導く反応と同様の反応条件下にて行われる。

反応工程式-13

15

5

20 [式中、 R^1 及び X_1 は前記に同じ。 R^{2e} はハロゲン原子、 $C1\sim6$ アルキルスルホニルオキシ基又はフェニル環上に $C1\sim6$ アルキル基が置換していてもよいフェニルスルホニルオキシ基を示す。]

化合物(41)から化合物(3b)に導く反応は、適当な溶媒中、塩基性化合物の存在下で行われる。

25 ここで使用できる溶媒は、反応を阻害しない溶媒を広く使用できる。このような溶媒としては、例えば、DMSO、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラリン、流動パラフィン等の炭化水素系溶媒、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素系溶媒、THF、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジグライム

等のエーテル系溶媒、アセトン、酢酸エチル又は上記混合溶媒等を挙げることができる。

塩基性化合物としては、上記一般式(2)の化合物と一般式(3 a)の化合物との反応で用いられる塩基性化合物と同じものを使用できる。

5 塩基性化合物は、化合物(41)に対して、通常等モル〜過剰モル、好ましくは $1\sim 5$ 倍モル、より好ましくは $1\sim 2$ 倍モル用いるのがよい。

10 上記の方法で得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、化合物(3b)を反応混合物から単離精製することができる。

[反応工程式-14]

15

[式中、 R^1 、 R^2 及びnは前記に同じ。]

20 化合物 (5) から化合物 (3 f) に導く反応は、例えば、適当な溶媒中、塩基性化合物の存在下に、化合物 (5) をトリメチルスルホキソニウムヨージドで処理することにより行われる。

ここで使用できる溶媒は、反応を阻害しない溶媒を広く使用できる。このような溶媒としては、例えば、DMSO、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラリン、流動パラフィン等の炭化水素系溶媒、THF、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジグライム等のエーテル系溶媒又は上記混合溶媒等を挙げることができる。

塩基性化合物としては、水素化ナトリウム、ナトリウムアミド、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムtert-ブトキシド等の金属アル

コラート等を挙げることができる。

これらの塩基性化合物は、化合物(5)に対して、通常等モル〜過剰モル、好ましくは1~3倍モル、より好ましくは1~1.5倍モル用いるのがよい。

また、トリメチルスルホキソニウムヨージドは、化合物(5)に対して、通常 5 等モル〜過剰モル、好ましくは1〜3倍モル、より好ましくは1〜1.5倍モル 用いるのがよい。

この反応の反応温度は、通常 $0\sim80$ $^{\circ}$ 、好ましくは $10\sim50$ $^{\circ}$ 、より好ましくは $20\sim35$ $^{\circ}$ である。また、反応時間は、通常 $1\sim24$ 時間、好ましくは $1\sim12$ 時間、より好ましくは $1\sim4$ 時間である。

10 上記の方法で得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、化合物(3 f)を反応混合物から単離精製することができる。

・ 化合物(6)から化合物(3 f)に導く反応は、例えば、適当な溶媒中、化合 15 物(6)を過酸化物で処理することにより行われる。

ここで使用できる反応溶媒は、反応を阻害しない溶媒を広く使用できる。このような溶媒としては、例えば、水、メタノール、エタノール等のアルコール系溶媒、DMF、DMSO、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラリン、流動パラフィン、シクロヘキサン等の炭化水素系溶媒、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素系溶媒、THF、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジグライム等のエーテル系溶媒、又は上記混合溶媒等を挙げることができる。

過酸化物としては、例えば、メタクロロ過安息抗酸(mCPBA)、過安息香酸、過酢酸、過酸化水素等が挙げられる。

25 これら過酸化物は、化合物(6)に対して、通常等モル〜2倍モル、好ましくは等モル〜1.5倍モル、より好ましくは等モル〜1.3倍モル使用すればよい。この反応の反応温度は、通常 $0\sim80$ ^{\mathbb{C}}、好ましくは $0\sim50$ ^{\mathbb{C}}、より好ましくは $20\sim35$ ^{\mathbb{C}}である。また、反応時間は、通常10624時間、好ましくは $1\sim12$ 時間、より好ましくは $1\sim8$ 6時間である。

上記の方法で得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、化合物(3 f)を反応混合物から単離精製することができる。

5 光学活性な化合物(3 f)は、例えば、化合物(6)から次のようにして製造 される。

この反応に使用される溶媒としては、本反応を阻害しない溶媒を広く使用できる。このような溶媒としては、例えば、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラリン、流動パラフィン、シクロヘキサン等の炭化水素系溶媒、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素系溶媒、THF、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジグライム等のエーテル系溶媒、又はこれらの混合溶媒等を挙げることができる。

クメンヒドロパーオキシド又はtertーブチルヒドロペルオキシドは、化合 20 物(6)に対して、通常0.1モル~2倍モル、好ましくは0.1モル~1.5倍モル、より好ましくは0.1倍~等モル使用すればよい。

Ti(O-iso-C $_3$ H $_7$) $_4$ は、化合物(6)に対して、通常 0. $1\sim 2$ 倍モル、好ましくは 0. $1\sim 1$. 5 倍モル、より好ましくは 0. 1 倍モル~等モル使用すればよい。

25 光学活性な酒石酸C1~6アルキルエステル類(D又はL-体)は、化合物 (6)に対して、通常等モル~2倍モル、好ましくは等モル~1.5倍モル、より好ましくは等モル~1.3倍モル使用すればよい。

この反応の反応温度は、通常 $-50\sim30$ °C、好ましくは $-20\sim20$ °C、より好ましくは $-20\sim5$ °Cである。また、反応時間は、通常 $1\sim48$ 時間、好ま

しくは4~24時間、より好ましくは4~12時間である。

化合物 (5) 又は化合物 (6) において、 R^1 及びー (CH_2) $_n$ R^2 a が、隣接する炭素原子と共に窒素原子を介して互いに結合してピペリジン環を形成している場合には、上記と同様にして、化合物 (3 f) において、 R^1 及びー

5 $(CH_2)_n R^{2a}$ が、隣接する炭素原子と共に窒素原子を介して互いに結合してピペリジン環を形成している化合物(化合物(3c))に導くことができる。

上記の方法で得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、光学活性な化合物(3 f)を反応混合物から単離精製することができる。

本発明の化合物(1)で表される2、3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2、1-b] オキサゾール化合物及び上記反応工程式において得られる中間体は、立体異性体、光学異性体を含む。

[反応工程式-15]

15

25

10

$$0 \xrightarrow{R^{1}} (CH_{2})_{n}OSO_{2}R^{3}aa \xrightarrow{R^{2}aH(5)} 0 \xrightarrow{R^{1}} (CH_{2})_{n}R^{2}a$$
(3g)
(3h)

[式中、R^{3aa}、R¹、R^{2a}及びnは前記に同じ。]

20 化合物 (3g) から化合物 (3h) に導く反応は、例えば、反応工程式-6に おける化合物 (1-A-A7) から化合物 (1b) に導く反応と同様の反応条件下 にて行われる。

「反応工程式-16]

[式中、 R^1 、X、n及びmは前記に同じ。 R^{11a} は、基 -(w)。 -(w) -(w)

ルコキシカルボニル基を示す。)を示す。 R 11b は、基 $^{-\text{Wp-N}}$ $^{\text{MH}}$ 又は基 $^{-\text{Wp-N}}$ を示す。

R ^{1 1 c}は、基-w。- N N-R^{15b} 又は基一 N-R^{16b} を示す。

 $(R^{15b}$ 及び R^{16b} はそれぞれ $C3\sim8$ シクロアルキル基を示す。) R^{A} はC35 -8シクロアルキル基を示す。]

化合物(E-1)を化合物(E-2)に導く反応は、化合物(E-1)を加水 分解することにより導くことができる。

該加水分解反応は、適当な溶媒中又は無溶媒で、酸又は塩基性化合物の存在下 に実施することができる。用いられる溶媒としては例えば水、メタノール、エタ 10 ノール、イソプロパノール、tertーブタノール等の低級アルコール類、アセ トン、メチルエチルケトン等のケトン類、ジエチルエーテル、ジオキサン、テト ラヒドロフラン、モノグライム、ジグライム等のエーテル類、酢酸、蟻酸等の脂 肪酸類、酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類、クロロホルム、ジクロロメタ ン、ジクロロエタン、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、ジメチルスルホキ シド、N、N-ジメチルホルムアミド、ヘキサメチル燐酸トリアミド又はこれら の混合溶媒等を挙げることができる。酸としては例えば塩酸、硫酸、臭化水素酸 等の鉱酸、蟻酸、酢酸、トリフルオロ酢酸、P-トルエンスルホン酸等のスルホ ン酸等の有機酸等を挙げることができ、また塩基性化合物としては、例えば炭酸 ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の炭酸塩、 水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム、水酸化リチウム等の金 20 属水酸化物等を挙げることができる。該反応は、通常0~200℃程度、好まし くは0~150℃程度にて好適に進行し、一般に10分~30時間程度で終了す る。

酸又は塩基性化合物の使用量は、化合物(E-1)1モルに対して少なくとも 25 等モル、好ましくは等モル~10モルであるが、反応溶媒として大過剰に用いてもよい。

加水分解後、反応を完結させるために適当な溶媒中、塩基性化合物の存在下に通常 $0\sim100$ ℃、好ましくは、室温 ~70 ℃付近にて、 $1分\sim30$ 分程度反応させてもよい。ここで使用される塩基性化合物としては、例えばトリエチルアミ

ン、トリメチルアミン、ピリジン、ジメチルアニリン、N-エチルジイソプロピ ルアミン、ジメチルアミノピリジン、N-メチルモルホリン、1, 5-ジアザビ シクロ「4.3.0]ノネンー5(DBN)、1,8-ジアザビシクロ「5.4. 0] ウンデセンー7 (DBU)、1, 4ージアザビシクロ[2.2.2] オクタ ン(DABCO)等の有機塩基、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナト リウム、炭酸水素カリウム等の炭酸塩、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水 酸化カルシウム等の金属水酸化物、水素化カリウム、水素化ナトリウム、カリウ ム、ナトリウム、ナトリウムアミド、ナトリウムメチラート、ナトリウムエチラ ート等の金属アルコラート類等の無機塩基等が挙げられる。用いられる溶媒とし てはクロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン、四塩化炭素等のハロゲン 化炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジエチル エーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等 のエーテル類、酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸イソプロピル等のエステル類、メ タノール、エタノール、イソプロパノール、プロパノール、ブタノール、3-メ 15 トキシー1-ブタノール、エチルセロソルブ、メチルセロソルブ等のアルコール 類、アセトニトリル、ピリジン、アセトン、水、N, N-ジメチルアセタミド、 N, N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ヘキサメチル燐酸トリ アミド等の非プロトン性極性溶媒又はこれらの混合溶媒等が挙げられる。

化合物(E-2)と化合物(13)との反応は、無溶媒又は適当な溶媒中、還20 元剤の存在下に行われる。

ここで使用される溶媒としては例えば水、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール、tertーブタノール、エチレングリコール等の低級アルコール類、アセトニトリル、蟻酸、酢酸、トリフルオロ酢酸等の脂肪酸、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、モノグライム、ジグライム等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類又はこれらの混合溶媒等を例示できる。還元剤としては例えば蟻酸、蟻酸ナトリウム、酢酸ナトリウム等の脂肪酸アルカリ金属塩、水素化硼素ナトリウム、水素化アノ硼素ナトリウム、水素化トリアセチルオキシ硼素ナトリウム、水素化ア

ルミニウムリチウム等の水素化還元剤又はこれらの水素化還元剤の混合物、パラジウムー黒、パラジウムー炭素、酸化白金、白金黒、ラネーニッケル等の接触水素還元剤等を例示できる。

還元剤として蟻酸、を使用する場合、反応温度は通常室温~200℃程度、好ましくは50~150℃程度付近が適当であり、反応は10分~10時間程度にて終了する。蟻酸の使用量は化合物(E-2)に対して大過剰量使用するのがよい。

また水素化還元剤を使用する場合、反応温度は通常-80~100℃程度、好ましくは-80~70℃程度が適当であり、30分~100時間程度で反応は終10 了する。水素化還元剤の使用量は、化合物(E-2)に対して通常等モル~20倍モル量程度、好ましくは等モル~6倍モル程度とするのがよい。特に還元剤として水素化アルミニウムリチウムを使用する場合、溶媒としてジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、モノグライム、ジグライム等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類を使用するのが好ましい。

15 該反応には、トリメチルアミン、トリエチルアミン、N-エチルジイソプロピルアミン等のアミン類を添加してもよい。又モレキュラーシーヴス 3A(MS-3A)、モレキュラーシーヴス 4A(MS-4A)等のモレキュラーシーヴスを添加してもよい。

更に接触水素還元剤を用いる場合は、通常常圧 ~ 20 気圧程度、好ましくは常 $E\sim 10$ 気圧程度の水素雰囲気中で、又は蟻酸、蟻酸アンモニウム、シクロヘキセン、放水ヒドラジン等の水素供与剤の存在下で、通常 $-30\sim 100$ $^{\circ}$ 程度、好ましくは $0\sim 60$ $^{\circ}$ 程度の温度で反応を行なうのがよいく、通常 $1\sim 12$ 時間程度で反応は終了する。接触水素還元剤の使用量としては化合物(E-2)に対して通常 $0.1\sim 40$ 重量%、好ましくは $1\sim 20$ 重量%程度とするのがよい。

25 又化合物(13)の使用量は、化合物(E-2)に対して通常少なくとも等モル量、好ましくは等モル~大過剰量とするのがよい。

[反応工程式-17]

5 [式中、 R^1 、X、n、m、W及びoは前記に同じ。 R^{14b} は、 $C1\sim6$ アルコキシカルボニル基を示す。 R^{14Aa} は水素原子、水酸基、 $C1\sim6$ アルコキシ基又はフェニル基(フェニル環上にはハロゲン原子が置換していてもよい)をい示す。]

化合物 (Eaa6-1) を化合物 (Eaa5-1) に導く反応は、前記反応工 10 程式-16の化合物 (E-1) を化合物 (E-2) に導く反応と同様の条件下に 行われることができる。

[反応工程式-18]

[式中、R¹、n及びX₂は前記に同じ。R⁵²は水素原子又はC1~6アルキル基を示す。R^{26b}は、ハロゲン原子、シアノ基、置換基としてC1~6アルキル基を有することのあるアミノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基、C1~6アルコキシカルボニル基、カルボキシル基、フェノキシ基(該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。)、アミノC1~6アルキル基(下ミノ基上には、置25 換基としてC1~6アルキル基及びフェニル基(該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びフェニルを1を下ルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。)なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。)又はフェニルC1~6アルコキシ基(該フェニル環上には置換基としてハ

ロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1 種置換していてもよい。)を示す。 pは $0\sim4$ を示す。 R^{26a} は、基 $-NHR^{26h}$ (R^{26h} は水素原子又は $C1\sim6$ アルキル基を示す。)又は基

- 5 $-W_1-NHR^{26c}$ (W_1 は $C1\sim6$ アルキレン基を示す。 R^{26c} は水素原子、 $C1\sim6$ アルキル基又はフェニル基(該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。)を示す。 R^{26d} は、基-N($R^{26e'}$) R^{26h} 又は基
- $-W1-N(R^{26c})R^{26e}$ を示す。 R^{26e} は、フェニル基(該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。)又は $C1\sim6$ アルキル基を示す。 $R^{26e'}$ は $C1\sim6$ アルキル基を示す。 $R^{26e'}$ は $C1\sim6$ アルキル基を示す。 $R^{26e'}$
- 15 R^{26g} は、基-N (R^{26h}) CH (R^{52}) R^{26f} 又は基 $-W_1-N$ (R^{26c}) CH (R^{52}) R^{26f} を示す。但し前記下線部分の総炭素数は6を超えないものとする。

化合物(Fd-1)と化合物(15)との反応は、一般に適当な溶媒中、塩基性化合物の存在下又は非存在下にて行われる。

20 用いられる不活性溶媒としては例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、モノグライム、ジグライム等のエーテル類、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール、tertーブタノール、エチレングリコール等の低級アルコール類、酢酸等の脂肪酸、酢酸エチル、酢酸メチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、ピリジン、ジメチルスルホキシド、N, Nージメチルホルムアミド、ヘキサメチル燐酸トリアミド又はこれらの混合溶媒等を挙げることができる。また塩基性化合物としては例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム、炭酸

セシウム等の炭酸塩、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム等の金属水酸化物、水素化ナトリウム、水素化カリウム、カリウム、ナトリウム、ナトリウム、ナトリウムアミド、ナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート、ナトリウム nーブトキシド等の金属アルコラート類、ピリジン、イミダゾール、Nーエチル ジイソプロピルアミン、ジメチルアミノピリジン、トリエチルアミン、トリメチルアミン、ジメチルアニリン、Nーメチルモルホリン、1,5ージアザビシクロ [4.3,0]ノネンー5(DBN),1,8ージアザビシクロ [5.4.0]ウンデセンー7(DBU)、1,4ージアザビシクロ [2.2.2]オクタン (DABCO)等の有機塩基又はこれらの混合物を挙げることができる。化合物 (15)の使用量は、化合物(Fd-1)に対して少なくとも等モル量、好ましくは、等モル~10倍モル量使用するのがよい。塩基性化合物の使用量は、化合物(Fd-1)に対して少なくとも等モル量、好ましくは等モル~10倍モル量使用するのがよい。该反応は、通常0~200℃、好ましくは、0~150℃程度にて行われ、一般に5分~80時間程度にて反応は終了する。

該反応系内には沃化ナトリウム、沃化カリウム等のアルカリ金属ハロゲン化合 15 物等を添加してもよし、相間移動触媒を添加してもよい。相関移動触媒としては、 テトラブチルアンモニウムクロリド、テトラブチルアンモニウムブロミド、テト ラブチルアンモニウムフルオリド、テトラブチルアンモニウムアイオダイド、テ トラブチルアンモニウムヒドロキシド、亜硫酸水素テトラブチルアンモニウム、 トリブチルメチルアンモニウムクロリド、トリブチルベンジルアンモニウムクロ 20 リド、テトラペンチルアンモニウムクロリド、テトラペンチルアンモニウムブロ ミド、テトラヘキシルアンモニウムクロリド、ベンジルジメチルオクチルアンモ ニウムクロリド、メチルトリヘキシルアンモニウムクロリド、ベンジルジメチル オクタデカニルアンモニウムクロリド、メチルトリデカニルアンモニウムクロリ ド、ベンジルトリプロピルアンモニウムクロリド、ベンジルトリエチルアンモニ 25 ウムクロリド、フェニルトリエチルアンモニウムクロリド、テトラエチルアンモ ニウムクロリド、テトラメチルアンモニウムクロリド等の炭素数1-18の直鎖 又は分枝鎖状のアルキル基、フェニルC1~6アルキル基及びフェニル基なる群よ り選ばれた基が置換した4級アンモニウム塩等、テトラブチルホスホニウムクロ

20

25

リド等の炭素数1-18の直鎖又は分枝鎖状のアルキル基が置換したホスホニウム塩等、1-ドデカニルピリジニウムクロリド等の炭素数1-18の直鎖又は分枝鎖状のアルキル基が置換したピリジニウム塩等を例示できる。相間移動触媒の使用量は、化合物(Fd-1)に対して、通常0.1モルー等モル量、好ましくは、0.1等モル-0.5倍モル量使用するのがよい。化合物(Fd-1)と化合物(16)の反応は、前記反応工程式-16の化合物(150)と化合物(150)の反応と同様の条件下に行われることができる。

[反応工程式-19]

$$10 \qquad O_{2}N \qquad N \qquad (CH_{2})_{n}-O \qquad (X)m \qquad R^{12a} \qquad N \qquad (CH_{2})_{n}-O \qquad (W)O \qquad H \qquad (W)O \qquad H \qquad (Ea-2) \qquad (W)O \qquad (Ea-3) \qquad (CH_{2})_{n}-O \qquad (W)O \qquad (CH_{2})_{n}-O \qquad (W)O \qquad (CH_{2})_{n}-O \qquad (W)O \qquad (CH_{2})_{n}-O \qquad (W)O \qquad (H^{12a} \subset R^{52} \subset R^{12a} \subset R^{12a}$$

[式中、 R^1 , n, W, X, m, o、 R^{52} 及び X_2 は前記に同じ。 R^{12a} はC1~6アルコキシカルボニル基を示す。 R^{13a} は、水素原子、C1~6アルキル基、C1~6アルカノイル基、C1~6アルコキシカルボニル基、フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基及びフェノキシ基(該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。)からなる群より選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。又アルキル部分には、C1~6アルコキシイミノ基が置換していてもよい。)、フェニル基(該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル

基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基なる群から選ばれた基を 少なくとも1種置換していてもよい。)、ピリジル基(該ピリジン環上には、少 なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい。)、フェノキシC1~6ア ルキル基(該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未 置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基 なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。) 又はベンゾイル C1~6アルキル基(該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン 置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6ア ルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。) を示 す。R^{12b}は、C1~6アルキル基、C1~6アルコキシカルボニル基、フェ ニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もし くは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アル コキシ基及びフェノキシ基(該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハ ロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1 ~6アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよ 15 い。)からなる群より選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。又アル キル部分には、C1~6アルコキシイミノ基が置換していてもよい。)、フェニ ル基(該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換 のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基なる 群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。)、ピリジル基(該ピ 20 リジン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい。)、フ ェノキシC1~6アルキル基(該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、 ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよ い。)又はベンゾイルC1~6アルキル基(該フェニル環上には置換基としてハ 25 ロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又 は未置換のC1~6アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換し ていてもよい。)を示す。R^{12c}は、C1~6アルカノイル基又はベンゾイル 基(該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の

 $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。)を示す。R12d は、水素原子、 $C1\sim6$ アルキル基、フェニル $C1\sim6$ アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基及びフェノキシ基(該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。)からなる群より選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。)からなる群より選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。)、フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、

- 10 ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基及びフェノキシ基(該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。)からなる群より選ばれた基を少なくとも1種置換していても
- 15 よい。)、フェノキシC1~6アルキル基(該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。)又はベンゾイルC1~6アルキル基(該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロ
- 20 ゲン置換又は未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも 1種置換していてもよい。)を示す。一般式(Ea-5)の基
 - (W) o N (R $^{1\,3\,a}$) \underline{CH} (R $^{5\,2}$) R $^{1\,2\,d}$ の下線部分の総炭素数は 6 を超えないものとする。]

化合物(Ea-1)を化合物(Ea-2)に導く反応は、前記反応工程式-125 6の化合物(E-1)を化合物(E-2)に導く反応と同様の条件下に行われる ことができる。

化合物(Ea-2)と化合物(17)の反応は、前記反応工程式-18の化合物(Fd-1)と化合物(15)の反応と同様の条件下に行われることができる。 化合物(Ea-2)と化合物(18)の反応は、化合物(Ea-2)と化合物

ることができる。

(18)のカルボン酸とを通常のアミド結合生成反応にて反応させる方法である。 該アミド結合生成反応としては公知のアミド結合生成反応の条件を容易に運用す ることができる。例えば(イ)混合酸無水物法、即ちカルボン酸(18)にアル キルハロカルボン酸を反応させて混合酸無水物とし、これにアミン(Ea-2) を反応させる方法、(ロ)活性エステル法、即ちカルボン酸(18)をフェニル、 pーニトロフェニルエステル、N-ヒドロキシコハク酸イミドエステル、1-ヒ ドロキシベンゾトリアゾールエステル等の活性エステル、又はベンズオキサゾリ ンー2ーチオンとの活性アミドとし、これにアミン(E a - 2)を反応させる方 法、(ハ)カルボジイミド法、即ちカルボン酸(18)にアミン(Ea-2)を ジシクロヘキシルカルボジイミド、1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-10 エチルカルボジイミド(WSC)、カルボニルジイミダゾール等の活性化剤の存 在下に縮合反応させる方法、(ニ)その他の方法、例えばカルボン酸(18)を 無水酢酸等の脱水剤によりカルボン酸無水物とし、これにアミン(Ea-2)を 反応させる方法、カルボン酸(18)と低級アルコールとのエステルにアミン (E a ー 2)を高圧高温下に反応させる方法、カルボン酸(1 8)の酸ハロゲン 15 化物、即ちカルボン酸ハライドにアミン(Ea-2)を反応させる方法等を挙げ

上記混合無水物法 (イ) において用いられる混合酸無水物は、通常のショッテンーバウマン反応により得られ、これを通常単離することなくアミン (Ea-2) と反応させることにより一般式 (Ea-4) の本発明化合物が製造される。上記ショッテンーバウマン反応は塩基性化合物の存在下に行われる。用いられる塩基性化合物としては、ショッテンーバウマン反応に慣用の化合物例えばトリエチルアミン、トリメチルアミン、ピリジン、ジメチルアニリン、Nーエチルジイソプロピルアミン、ジメチルアミノピリジン、Nーメチルモルホリン、1,5-25 ジアザビシクロ [4.3.0] ノネン-5 (DBN)、1,8-ジアザビシクロ [5.4.0] ウンデセン-7 (DBU)、1,4-ジアザビシクロ [2.2.2] オクタン (DABCO) 等の有機塩基、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の炭酸塩、水酸化ナトリウム、水酸化カ

リウム、水酸化カルシウム等の金属水酸化物、水素化カリウム、水素化ナトリウ

ム、カリウム、ナトリウム、ナトリウムアミド、ナトリウムメチラート、ナトリ ウムエチラート等の金属アルコラート類等の無機塩基等が挙げられる。該反応は、 通常−20~100℃程度、好ましくは0~50℃程度において行われ、反応時 間は5分~10時間程度、好ましくは5分~2時間程度である。得られた混合酸 無水物とアミン(Ea-2)との反応は通常-20~150 C程度、好ましくは 5 10~50℃程度にて行われ、反応時間は5分~10時間程度、好ましくは5分 ~5時間程度である。混合酸無水物法は一般に溶媒中で行われる。用いられる溶 媒としては混合酸無水物法に慣用の溶媒がいずれも使用可能であり、具体的には クロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン、四塩化炭素等のハロゲン化炭 化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジエチルエー テル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエ ーテル類、酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸イソプロピル等のエステル類、N, N ージメチルアセタミド、N, Nージメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、 ヘキサメチル燐酸トリアミド等の非プロトン性極性溶媒又はこれらの混合溶媒等 が挙げられる。混合酸無水物法において使用されるアルキルハロカルボン酸とし 15 ては例えばクロロ蟻酸メチル、ブロモ蟻酸メチル、クロロ蟻酸エチル、ブロモ蟻 酸エチル、クロロ蟻酸イソブチル等が挙げられる。該法におけるカルボン酸 (1 8) とアルキルハロカルボン酸とアミン (Ea-2) の使用割合は通常等モルず つとするのがよいが、アミン(Ea-2)に対してアルキルハロカルボン酸及び カルボン酸(18)はそれぞれ等モル~1.5倍モル量程度の範囲内で使用する 20 ことができる。

また前記活性化剤の存在下に縮合反応させる方法(ハ)においては、適当な溶媒中、塩基性化合物の存在下又は非存在下に行われることができる。ここで使用される溶媒及び塩基性化合物としては、下記その他の方法(ニ)のカルボン酸ハライドにアミン(Ea-2)を反応させる方法で用いた溶媒をいずれも使用することができる。活性化剤の使用量は、化合物(Ea-2)に対して少なくとも等モル量、好ましくは等モル~5倍モル量使用するのがよい。活性化剤としてWSCを使用する場合は、反応系内に1-ヒドロキシベンゾトリアゾールを添加すると反応は有利に進行する。該反応は、通常-20~180℃程度、好ましくは0

~150℃程度にて行われ、一般に5分~90時間程度で反応は完結する。

また前記その他の方法(二)の内で、カルボン酸ハライドにアミン(Ea-

- 2)を反応させる方法を採用する場合、該反応は塩基性化合物の存在下に、適当な溶媒中で行われる。用いられる塩基性化合物としては、公知のものを広く使用でき、例えば上記書店ーバウマン反応に用いられる塩基性化合物をいずれも使用することができる。又用いられる溶媒としては、例えば上記混合酸無水物法に用いられる溶媒の他に、メタノール、エタノール、イソプロパノール、プロパノール、ブタノール、3ーメトキシー1ーブタノール、エチルセロソルブ、メチルセロソルブ等のアルコール類、アセトニトリル、ピリジン、アセトン、水等を挙げ
- 10 ることができる。アミン(Ea-2)とカルボン酸ハライドとの使用割合としては、特に限定がなく広い範囲内で適宜選択すればよいが、通常前者に対して後者を少なくとも等モル量程度、好ましくは等モル~5倍モル量程度用いるのがよい。該反応は通常-20~180℃程度、好ましくは0~150℃程度にて行われ、一般に5分~50時間程度で反応は完結する。
- 15 更に上記一般式-19に示すアミド結合生成反応は、カルボン酸(18)とアミン(Ea-2)とを、ジフェニルホスフィニッククロリド、フェニル-N-フェニルホスホラミドクロリデート、ジエチルクロロホスフェート、シアノリン酸ジエチル、ジフェニルリン酸アジド、ビス(2-オキソー3-オキサゾリジニル)ホスフィニッククロリド等の燐化合物の縮合剤の存在下に反応させる方法によっても実施することができる。

該反応は、上記カルボン酸ハライドにアミン(Ea-2)を反応させる方法で用いられる溶媒及び塩基性化合物の存在下に、通常 $-20\sim150$ $^{\circ}$ $^{\circ}$ 程度、好ましくは $0\sim100$ $^{\circ}$ 程度付近にて行われ、一般に $5分\sim30$ 時間程度にて反応は終了する。縮合剤及びカルボン酸(18)の使用量はアミン(Ea-2)に対してそれぞれ少なくとも等モル量程度、好ましくは等モル $^{\circ}$ $^{\circ}$ 2倍モル量程度使用するのがよい。

化合物 (Ea-2) と化合物 (19) の反応は、前記反応工程式-16 の化合物 (E-2) と化合物 (13) の反応と同様の条件下に行われることができる。

[反応工程式-20]

[式中、 R^1 , n, R^{52} 、p及び X_2 は前記に同じ。 R^{19a} は、(F1)~(F11)で示される基を示す。

R⁵³は、フェノキシ基(該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロ ゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1-6アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。)、 10 ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置 換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基、置換基としてC1~6アルキル基及 びフェニルC1~6アルキル基(該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、 ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよ 15 い。) なる群から選ばれた基を有することのあるアミノ基、ピペラジニル基(該 ピペラジン環上には置換基としてフェニルC1~6アルキル基(該フェニル環上 には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基 及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基なる群から選ばれた基を少 なくとも1種置換していてもよい。) 又はピペリジニル基(該ピペリジン環上に 20 は少なくとも1個のアミノ基が置換していてもよい。該アミノ基上には、フェニ ル基(該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換 のC1-6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基なる 群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。) 及びC1~6アルキ ル基なる群から選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。)を示す。 25 R⁵⁴は、フェニルC1~6アルキル基(該フェニル環上には置換基としてハロ ゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1-6アルキル基及びハロゲン置換又は 未置換のC1~6アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換して いてもよい。)を示す。R⁵⁵は、フェニルC1~6アルキル基(該フェニル環

10

15

20

25

上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。)又はフェニル基(該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。)を示す。一般式(F3-3)の基CH(R^{52}) R^{55} の総炭素数は6を超えないものとする。]

化合物(F3-1)と化合物(20)の反応は、前記反応工程式-180化合物(Fd-1)と化合物(15)の反応と同様の条件下に行われることができる。

化合物 (F3-1) と化合物 (21) の反応は、前記反応工程式-16の化合物 (E-2) と化合物 (3) の反応と同様の条件下に行われることができる。 「反応工程式-21]

$$O_{2}N = O_{2}N = O$$

「式中、R¹、n、X、R⁴⁷、R⁴⁸及びmは前記に同じ。]

化合物(E18-1)と化合物(27)の基の反応は、適当な不活性溶媒中、 塩基性化合物の存在下又は非存在下に反応させることにより行なうことができる。

使用される塩基性化合物としては、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の無機塩基性化合物、酢酸ナトリウム等の脂肪酸アルカリ金属塩、ピペリジン、トリエチルアミン、トリメチルアミン、ピリジン、ジメチルアニリン、Nーエチルジイソプロピルアミン、ジメチルアミノピリジン、Nーメチルモルホリン、1,5ージアザビシクロ[4.3.0]ノネン-5(DBN)、1,8ージアザビシクロ[5.4.0]ウンデセン-7(DBU)、1,4ージアザビシクロ[2.2.2]オクタン(DABCO)等の有機塩基を例示できる。使用される不活性溶媒としては、反応に悪影響を及ぼさないものであればいずれでもよいが、例えば水、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、モノグライム、ジグライム等のエーテル類、ジクロロメタン、ジクロロ

10

15

20

25

エタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール、tert-ブタノール、エチレングリコール等の低級アルコール類、酢酸等の脂肪酸、酢酸エチル、酢酸メチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、ピリジン、ジメチルスルホキシド、N,Nージメチルホルムアミド、ヘキサメチル燐酸トリアミド又はこれらの混合溶媒等を挙げることができる。化合物(27)の使用量は、化合物(E18-1)に対して通常少なくとも等モル量、好ましくは等モル~5倍モル量程度使用するのがよい。反応温度は、通常室温~200℃、好ましくは室温~150℃程度とするのがよく、一般に5分~30時間程度で反応は終了する。

[反応工程式-22]

[式中、 R^1 、n、X、m、 X_2 及び R^{52} は前記に同じ。 R^{47a} は、水素原子を示す。 R^{48a} は、水素原子、 $C1\sim 6$ アルキル基、フェニル基(該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の $C1\sim 6$ アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の $C1\sim 6$ アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。)又はピリジル基(該ピリジン環上には置換基としてハロゲン置換又は未置換の $C1\sim 6$ アルキル基を少なくとも1種置換していてもよい。)を示す。 R^{47b} は、 $C1\sim 6$ アルキル基;フェニル基(該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の $C1\sim 6$ アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の $C1\sim 6$ アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。)又はピリジル基(該ピリジン環上には置換基としてハロゲン置換又は未置換の $C1\sim 6$ アルキル基を少なくとも1種置換していてもよい。)又はピリジル基(該ピリジン環上には置換基としてハロゲン置換又は未置換の $C1\sim 6$ アルキル基を少なくとも1種置換していてもよい。)を示す。 R^{47c} は、水素原子、 $C1\sim 6$ アルキル基を示す。但し一般式(Ea18-5)の基一CH=N-N(R^{48a})

15

 $CH(R^{52})R^{47c}$ の下線部分の総炭素数は6を超えないものとする。]

化合物(E18-3)と化合物(28)の反応は、前記反応工程式-18の化合物(Fd-1)と化合物(15)の反応と同様の条件下に行われることができる。

5 化合物(E18-3)と化合物(29)の反応は、前記反応工程式-16の化合物(E-2)と化合物(13)の反応と同様の条件下に行われることができる。 [反応工程式-23]

$$O_{2N}$$
 N
 O_{1}
 O_{2N}
 O_{2N}

[式中、 R^1 , n, X, m, W及びoは前記に同じ。 R^{14Ab} 及び R^{14c} はそれぞれ $C1\sim6$ アルコキシ基を示す。]

化合物(E a a 1 7 - 6)を化合物(E a a 1 7 - 7)を導く反応は、前記反応工程式- 1 6 の化合物(E - 1)を化合物(E - 2)に導く反応と同様の条件下に行われることができる。

[反応工程式-24]

基、C1~6アルキルチオ基、1,2,4~トリアゾリル基、イソオキサゾリル基、イミダゾリル基、ベンゾチアゾリル基、2H~ベンゾトロアゾリル基、ピロリル基、ベンゾオキサゾリル基、ピペラジニル基(該ピペラジン環上には、置換基としてC1~6アルコキシカルボニル基及びフェニルC1~6アルキル基(該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。)なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。)なる群から選ばれた基を少なくとも1個のアミノ基が置換していてもよい。該アミノ基上には置換基としてC1~6アルキル基及びフェニル基(該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。)なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。)及びカルバモイル基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。)及びカルバモイル基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。)及

15 い。)を示す。]

化合物(E a a 4 - 1)と化合物(3 1)の反応は、適当な溶媒中、縮合剤の存在下に行われることができる。

ここで使用される溶媒としては、クロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸イソプロピル等のエステル類、メタノール、エタノール、イソプロパノール、プロパノール、ブタノール、ブタノール、ゴタノール、3ーメトキシー1ーブタノール、エチルセロソルブ、メチルセロソルブ等のアルコール類、アセトニトリル、ピリジン、アセトン、水、

25 N, N-ジメチルアセタミド、N, N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ヘキサメチル燐酸トリアミド等の非プロトン性極性溶媒又はこれらの混合溶媒等が挙げられる。その他に、メタノール、エタノール、イソプロパノール、プロパノール、ブタノール、3-メトキシー1-ブタノール、エチルセロソルブ、メチルセロソルブ等のアルコール類、アセトニトリル、ピリジン、アセトン、水

15

20

25

等を挙げることができる。使用される縮合剤としては、ジエチルアゾジカルボキシレート、tert-ブチルアゾジカルボキシレート等のアゾカルボキシレート 類及びトリフェニルホスフィン、トリフェニルホスフィン ポリマー サポーティッド (triphenylphosphine polymer supported) 等の燐化合物の混合物等を挙げることができる。該反応は、通常 $0\sim200$ °C、好ましくは $0\sim150$ °C程度にて好適に進行し、一般に $1\sim10$ 時間程度で終了する。縮合剤の使用量は、化合物(Eaa4-1)に対して少なくとも等モル量、好ましくは等モル~3倍モル量使用するのがよい。化合物(31)の使用量は、化合物(Eaa4-1)に対して少なくとも等モル量、好ましくは等モル~3倍・対して少なくとも等モル量、好ましくは等モル~2倍モル量使用するのがよい。

10 [反応工程式-25]

[式中、 R^1 , n, X, m, X_2 及び R^{52} は前記に同じ。 R^{46a} は、C1-6アルコキシカルボニル基を示す。 R^{46b} は、フェニル(該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。)、フェニル $C1\sim6$ アルキル基(該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。)、フェニル $C1\sim6$ アルコキシカルボニル基(該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。)又は $C1\sim6$ アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。)又は $C1\sim6$ アルコキシカルボニル基を示す。 R^{46c} は、フェニル(該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン属換又は未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の $C1\sim6$ アルキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置

換していてもよい。)又はフェニル $C1\sim6$ アルキル基(該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。)を示す。 R^{46d} は、フェニル基(該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。)又は $C1\sim6$ アルキル基を示す。]

化合物(E 1 4 - 1)を化合物(E 1 4 - 2)に導く反応は、前記反応工程式 - 1 6 の化合物(E - 1)を化合物(E - 2)に導く反応と同様の条件下に行わ れることができる。

化合物(E14-2)と化合物(34)の反応は、前記反応工程式-18の化合物(Fd-1)と化合物(15)の反応と同様の条件下に行われることができる。

化合物(E14-2) と化合物(33)の反応は、前記反応工程式-16の化15 合物(E-2) と化合物(13)の反応と同様の条件下に行われることができる。化合物(E14-2) と化合物(32)の反応は、適当な溶媒中、縮合剤の存在下に行われることができる。ここで使用される溶媒は、前記反応式-24の化合物(Eaa4-1) と化合物(31)の反応で用いた溶媒をいずれも使用することができる。縮合剤としては、N, N'-カルボニルジイミダゾール等をあげることができる。縮合剤としては、N, N'-カルボニルジイミダゾール等をあげることができる。化合物(32)及び縮合剤の使用量は、化合物(E14-2)1モルに対して少なくとも等モル、好ましくは1~2モル程度使用するのがよい。該反応は、通常0~150℃、好ましくは0~100℃付近にて1~30時間程度にて終了する。

[反応工程式-26]

[式中、 R^1 , n及び o は前記に同じ。 R^{24a} 及び R^{25a} は隣接する窒素原子を介してピペラジン環を形成する。該ピペラジン環上には、置換基として前記 R^{24} 及び R^{25} が隣接する窒素原子を介して形成する $5\sim6$ 員環の飽和の複素環で例示の置換基を少なくとも 1 種有していてもよいが、ピペラジン環の窒素原子上には、 $C1\sim6$ アルコキシカルボニル基を有するものとする。 R^{58} は、フェニル基(該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基 なる群から選ばれた基を少なくとも 1 種置換していてもよい。)を示す。

 R^{24b} 及び R^{25b} は、隣接する窒素原子を介してピペラジン環を形成する。該ピペラジン環上には、置換基として前記 R^{24} 及び R^{25} が隣接する窒素原子を介して形成する $5\sim6$ 員環の飽和の複素環で例示の置換基を少なくとも1種有していてもよい。ピペラジン環の窒素原子上には、水素原子を有するものとする。

20 R^{24c}及びR^{25c}は、隣接する窒素原子を介してピペラジン環を形成する。該ピペラジン環上には、置換基として前記R²⁴及びR²⁵が隣接する窒素原子を介して形成する5~6員環の飽和の複素環で例示の置換基を少なくとも1種有していてもよいが、ピペラジン環の窒素原子上には、フェニルC1~6アルコキシカルボニル基を(該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。)を有するものとする。〕

化合物 (Fca12-1) を化合物 (Fca12-2) に導く反応は、前記反応工程式-16の化合物 (E-1) を化合物 (E-2) に導く反応と同様の条件

下に行われることができる。

化合物(Fca12-2)と化合物(36)の反応は、前記反応工程式-25の化合物(E14-2)と化合物(32)の反応と同様の条件下に行われることができる。

5 [反応工程式-27]

15

25

$$10 \qquad \begin{array}{c} R^{468}OH \text{ (37)} \\ O_2N & N \\ \end{array} \qquad \begin{array}{c} R^1 \\ (CH_2)n-N \\ N \end{array} \qquad \begin{array}{c} N-COOR^{468} \\ \end{array}$$

[式中、 R^1 及びnは前記に同じ。 R^{45a} は、 $C1\sim6$ アルコキシカルボニル基を示す。 R^{46a} は、7ェニル基(7ェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。)を示す。]

化合物(Fd-39-1)を化合物(Fd-39-2)に導く反応は、前記反応工程式-16の化合物(E-1)を化合物(E-2)に導く反応と同様の条件下に行われることができる。

20 化合物 (Fd-39-2) と化合物 (37) の反応は、前記反応工程式-250 化合物 (E14-2) と化合物 (32) の反応と同様の条件下に行われることができる。

本発明化合物は、医薬的に許容される塩を包含する。斯かる塩としては、例えば塩酸塩、臭化水素酸塩、硝酸塩、硫酸塩、リン酸塩等の無機酸塩、メタンスルホン酸塩、pートルエンスルホン酸塩、酢酸塩、クエン酸塩、酒石酸塩、マレイン酸塩、フマル酸塩、リンゴ酸塩、乳酸塩等の有機酸塩等が挙げられる。

次に、本発明化合物を有効成分として含有する医療製剤について説明する。

上記医療製剤は、本発明化合物を通常の医療製剤の形態に製剤したものであって、通常使用される充填剤、増量剤、結合剤、付湿剤、崩壊剤、表面活性剤、滑

沢剤等の希釈剤あるいは賦形剤を用いて調製される。

このような医療製剤としては、治療目的に応じて種々の形態の中から選択でき、 その代表的なものとして錠剤、丸剤、散剤、液剤、懸濁剤、乳剤、顆粒剤、カプ セル剤、坐剤、注射剤(液剤、懸濁剤等)等が挙げられる。

5 錠剤の形態に成形する際に用いられる担体としては、公知のものを広く使用でき、例えば、乳糖、白糖、塩化ナトリウム、ブドウ糖、尿素、デンプン、炭酸カルシウム、カオリン、結晶セルロース等の賦形剤、水、エタノール、プロパノール、単シロップ、ブドウ糖液、デンプン液、ゼラチン溶液、カルボキシメチルセルロース、セラック、メチルセルロース、リン酸カリウム、ポリビニルピロリドン等の結合剤、乾燥デンプン、アルギン酸ナトリウム、寒天末、ラミナラン末、炭酸水素ナトリウム、炭酸カルシウム、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル類、ラウリル硫酸ナトリウム、ステアリン酸モノグリセリド、デンプン、乳糖等の崩壊剤、白糖、ステアリン、カカオバター、水素添加油等の崩壊抑制剤、第4級アンモニウム塩基、ラウリル硫酸ナトリウム等の吸収促進剤、グリセリン、15 デンプン等の保湿剤、デンプン、乳糖、カオリン、ベントナイト、コロイド状ケイ酸等の吸着剤、精製タルク、ステアリン酸塩、ホウ酸末、ポリエチレングリコール等の滑沢剤等が挙げられる。

更に、錠剤は、必要に応じて通常の錠皮を施した錠剤、例えば、糖衣剤、ゼラチン被包錠、腸溶被錠、フィルムコーティング錠あるいは二重錠、多層錠とすることができる。

丸剤の形態に成形する際に用いられる担体としては、公知のものを広く使用でき、例えば、ブドウ糖、乳糖、デンプン、カカオ脂、硬化植物油、カオリン、タルク等の賦形剤、アラビアゴム末、トラガカント末、ゼラチン、エタノール等の結合剤、ラミナラン、寒天等の崩壊剤等が挙げられる。

25 坐剤の形態に成形する際に用いられる担体としては、公知のものを広く使用でき、例えば、ポリエチレングリコール、カカオ脂、高級アルコール、高級アルコールのエステル類、ゼラチン、半合成グリセライド等が挙げられる。

注射剤として調製される場合は、液剤、乳剤及び懸濁剤は殺菌され、かつ血液 と等張であるのが好ましい。これらの液剤、乳剤及び懸濁剤の形態に成形する際 に用いられる希釈剤としては、公知のものを広く用いられているものを使用することができ、例えば、水、エタノール、プロピレングリコール、エトキシ化イソステアリルアルコール、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル類等が挙げられる。なお、この場合、等張性の溶液を調製するのに十分な量の食塩、ブドウ糖あるいはグリセリンを医薬製剤中に含有させてもよく、また通常の溶解補助剤、緩衝剤、無痛化剤等を、更に必要に応じて着色剤、保存剤、香料、風味剤、甘味剤等や他の医薬品を含有させてもよい。

医療製剤中に含有される本発明化合物の量は、特に限定されず広い範囲内から 10 適宜選択することができるが、通常、医療製剤中に本発明化合物を1~70重量 %含有させるのが好ましい。

本発明に係る医療製剤の投与方法としては特に制限はなく、各種製剤形態、患者の年齢、性別、疾患の状態、その他の条件に応じた方法で投与される。例えば、錠剤、丸剤、液剤、懸濁剤、乳剤、顆粒剤及びカプセル剤の場合には経口投与される。また、注射剤の場合には、単独であるいはブドウ糖、アミノ酸等の通常の補液と混合して静脈内に投与したり、更には必要に応じて単独で筋肉内、皮内、皮下もしくは腹腔内に投与することができる。坐剤の場合には、直腸内に投与される。

上記医療製剤の投与量は、用法、患者の年齢、性別、疾患の程度、その他の条 20 件に応じて適宜選択すればよく、通常、1日あたり体重1kgに対して0.01 ~100mg、好ましくは0.1~50mgを1回~数回に分けて投与される。

上記投与量は、種々の条件で変動するので、上記範囲より少ない投与量で充分な場合もあるし、また上記範囲を超えた投与量が必要な場合もある。

本発明化合物は、特に抗酸菌等の結核菌(結核菌属、非定型抗酸菌属)に対し 25 て特異的効力を有している。本発明化合物は、多剤耐性結核菌に対して優れた効果を有している。本発明化合物は、嫌気性菌に対して抗菌作用を有している。

本発明化合物は、インビトロで上記活性を示すばかりでなく、経口投与においても上記活性を発現する。

本発明化合物は、グラム陽性菌、グラム陰性菌等の一般細菌に対して幅広いス

ペクトラムを有している公知の抗菌剤に見られるような下痢症を誘発することもなく、既存薬と比べ副作用も少ないことから、長期間の服薬が可能な医療製剤になり得る。

本発明化合物は、抗酸菌感染症の主な感染臓器である肺組織に対し、良好に分 5 布し得、薬効の持続時間が長い、安全性に優れている等の特性を有することから、 高い治療効果が期待できる。

本発明化合物は、ヒト由来マクロファージ内寄生結核菌等の細胞内寄生菌に対しても既存の抗結核剤と比較して、強い殺菌力を示すことから、結核症の再燃率の低減、ひいては短期化学療法を可能にし、HIVと結核の混合感染が深刻な問題となっていることから行われている予防的投与薬の主軸としての使用も期待できるものである。

実施例

10

20

以下に、製剤例、参考例、実施例及び試験例を掲げる。

製剤例1

15 本発明化合物 1 0 0 g、アビセル (商標名、旭化成 (株) 製) 4 0 g、コーンスターチ 3 0 g及びステアリン酸マグネシウム 2 gを混合研磨後、糖衣 R 1 0 mmのキネで打錠した。

得られた錠剤をTC-5 (商標名、信越化学工業 (株) 製、ヒドロキシプロピルメチルセルロース) 10g、ポリエチレングリコール-6000 3g、ひまし油40g及び適量のエタノールからなるフィルムコーティング剤を用いて被膜を行い、上記組成のフィルムコーティング錠を製造した。

参考例1

4- (2-オキソプロピル) ピペラジン-1-カルボン酸ベンジルエステルの製造

25 ピペラジン-1-カルボン酸ベンジルエステル (2.03g、9.22ミリモル)のアセトニトリル (20ml)溶液に、炭酸カリウム (1.27g、9.22ミリモル)、N-エチルジイソプロピルアミン (0.80ml、4.61ミリモル)及びクロロアセトン (1.22ml、13.83ミリモル)を加え、2時間加熱還流した。不溶物を濾過し、酢酸エチルで洗浄した。母液及び洗液を合わ

せ、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=100/1)にて精製し、微黄色液体の4-(2-オキソプロピル)ピペラジン-1-カルボン酸ベンジルエステル(2.24g、収率88%)を得た。

5 ¹H-NMR (CDCl₃) δ p p m: 2. 15 (3H, s), 2. 35-2. 50 (4H, m), 3. 21 (2H, s), 3. 50-3. 62 (4H, m), 5. 13 (2H, s), 7. 27-7. 42 (5H, m)。

参考例2

10 4-(3-オキソブチル)ピペラジン-1-カルボン酸 t e r t -ブチルエステルの製造

メチルビニルケトン (2.3 g、32.9ミリモル)及びTHF (25 m l) の混合物に、氷冷下にてピペラジン-1-カルボン酸 t e r t -ブチルエステル (6 g、32.3ミリモル)をTHF (50 m l)に溶解した溶液を徐々に滴下

15 し、室温下にて3日間撹拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=20/1)にて精製し、微黄色オイルの4-(3-オキソブチル)ピペラジン-1-カルボン酸 tert ーブチルエステル (7.2g、収率87%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

20 1.46 (9H, s), 2.17 (3H, s), 2.30-2.42 (4H, m), 2.53-2.70 (4H, m), 3.33-3.47 (4H, m)。 対応する出発原料を用い、参考例1と同様にして、参考例3~参考例10の化合物を製造した。

参考例3

 $25 \quad 1 - [4 - (4 - h)]$ プロパカロメチルフェニル) ピペラジン-1 - 1 プロパン-2 - 1

収率99%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

2. 18 (3H, s), 2. 63-2. 68 (4H, m), 3. 27 (2H,

s), 3. 30-3. 45 (4H, m), 6. 92 (2H, d, J=8. 7 Hz), 7. 48 (2H, d, J=8. 7 Hz).

参考例4

1-(4-フェニルピペラジン-1-イル)プロパン-2-オン

5 収率95%

¹H-NMR (CDC1₃) δppm:

2. 19 (3H, s), 2. 65-2. 70 (4H, m), 3. 27-3. 32 (6H, m), 6. 97-7. 01 (2H, m), 7. 24-7. 31 (1H, m), 7. 37-7. 43 (2H, m).

10 参考例 5

1-[4-(4-クロロフェニル) ピペラジン-1-イル] プロパン-2-オン 収率99%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

2. 17 (3H, s), 2. 63-2. 67 (4H, m), 3. 18-3. 23

15 (4H, m), 3. 26 (2H, s), 6. 80-6. 87 (2H, m), 7. 17-7. 23 (2H, m),

参考例 6

1-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン-1-イル] プロパン-2-オン

20 収率100%

¹H-NMR (CDC1₃) δppm:

2. 18 (3H, s), 2. 63-2. 68 (4H, m), 3. 20-3. 25 (4H, m), 3. 26 (2H, s), 6. 85-6. 92 (2H, m), 7. 09-7. 13 (2H, m).

25 参考例 7

1-[4-(2-ピリジル) ピペラジン<math>-1-イル] プロパン-2-オン 収率9.7%

 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

2. 19 (3H, s), 2. 58-2. 63 (4H, m), 3. 25 (2H,

s), 3. 57-3. 62 (4H, m), 6. 60-6. 66 (2H, m), 7. 44-7. 51 (1H, m), 8. 17-8. 20 (1H, m)。 参考例8

1- [4-(2-ピリミジル) ピペラジン-1-イル] プロパン-2-オン

5 収率88%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

2. 19 (3H, s), 2. 53-2. 57 (4H, m), 3. 25 (2H,

s), 3. 86-3. 90 (4H, m), 6. 49 (1H, t, J=4. 8 Hz), 8. 30 (2H, d, J=4. 8Hz)

10 参考例 9

N-[1-(2-オキソプロピル) ピペリジンー<math>4-イル] -N-メチルーカルバミン酸 ter t-ブチルエステル

収率79%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

15 1. 46 (9H, s), 1. 57-1. 63 (2H, m), 1. 70-1. 91 (2H, m), 2. 04-2. 18 (2H, m), 2. 14 (3H, s), 2. 71-2. 74 (1H, m), 2. 74 (3H, s), 2. 90-2. 95 (2H, m), 3. 19 (2H, s).

参考例10

20 4-(2-オキソプロピル) ホモピペラジン-1-カルボン酸 t e r t - ブチル エステル

収率58%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 46 (9H, s), 1. 75-1. 93 (2H, m), 2. 14 (3H,

25 s), 2. 64-2. 76 (4H, m), 3. 32 (2H, s), 3. 38-3. 58 (4H, m),

参考例11

1-(4-トリフルオロメチルベンゾイル)-4-ヒドロキシピペリジンの製造4-ヒドロキシピペリジン(1g、9.89ミリモル)、トリエチルアミン

(1.7m1、11.9 \equiv 1 \mp 1 ν) 及び塩化メチレン (20m1) の混合物に、 氷冷下にて4 \rightarrow 1、1 ν 1、9 ν 2 が 塩化ベンゾイル (1.5m1、9.89 ν 2 が を加え、室温下にて30分撹拌した。反応液を水、飽和重曹水、飽和 食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧下に て濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ν 1) により精製し、白色粉末結晶の1 ν 1 (4 ν 1) により精製し、白色粉末結晶の1 ν 2 (4 ν 1) により精製し、白色粉末結晶の1 ν 3 を得た。 ν 4 が イル) ν 5 が を得た。

1. 36-2. 07 (4H, m), 3. 07-3. 70 (3H, m), 3. 91 10 -4. 32 (2H, m), 7. 51 (2H, d, J=8. 0Hz), 7. 68 (2H, d, J=8. 0Hz).

対応する出発原料を用い、参考例11と同様にして参考例12の化合物を製造 した。

参考例12

15 1- (4-トリフルオロメトキシベンゾイル) -4-ヒドロキシピペリジン 白色粉末結晶、収率100%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 34-2. 07 (4H, m), 3. 09-3. 80 (3H, m), 3. 91 -4. 32 (2H, m), 7. 25 (2H, d, J=7. 9Hz), 7. 45

20 (2H, d, J = 7.9 Hz).

参考例13

1-[2-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)エチル]-4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジンの製造

4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジン(1.87g、7.6 25 3ミリモル)、2-(2-ブロモエトキシ) テトラヒドロピラン(1.75g、8.4ミリモル)、炭酸カリウム(1.16g、8.38ミリモル)、ヨウ化ナトリウム(1.2g、8.01ミリモル)及びDMF(30ml)の混合物を10℃にて1時間撹拌した。反応液を室温に戻し、水中に注ぎ、酢酸エチルにより2回抽出した。有機相を合わせ、2回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸 マグネシウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=50/1)により精製し、無色オイルの1-[2-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)エチル]-4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン(1.69g、

5 収率59%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 39-2. 12 (10H, m), 2. 36-2. 53 (2H, m), 2. 68 (2H, t, J=6.1Hz), 2. 71-2. 92 (2H, m), 3. 43 -3. 63 (2H, m), 3. 78-3. 94 (2H, m), 4. 31-4. 47 (1H, m), 4. 57-4. 67 (1H, m), 6. 96 (2H, d, J=6)

8. 7 Hz), 7. 52 (2H, d, J = 8. 7 Hz).

参考例14

10

2- [4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジン-1-イル] エタ ノールの製造

- 15 参考例13で製造した1-[2-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)エチル]-4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン(1.69g、4.53ミリモル)、ピリジニウムpートルエンスルホネート(114mg、0.45ミリモル)及びエタノール(50ml)の混合物を60~70℃にて6時間撹拌した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に10%苛性ソーダを加え、塩化メチレンにより抽出した。飽和食塩水により洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=50/1)により精製し、無色オイルの2-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1ーイル]エタノール(1.19g、収率91%)を得た。
- 25 ¹H-NMR (CDCl₃) δ p p m: 1. 73-2. 10 (4H, m), 2. 31-2. 47 (2H, m), 2. 58 (2H, t, J=5. 5Hz), 2. 69-3. 00 (3H, m), 3. 63 (2H, t, J=5. 5Hz), 4. 33-4. 48 (1H, m), 6. 95 (2H, d, J=8. 6Hz), 7. 53 (2H, d, J=8. 6Hz).

参考例15

2- [2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) エトキシ] テトラヒドロピランの製造

4ーヒドロキシベンゾトリフルオリド(2.08g、12.83ミリモル)、
2ー(2ーブロモエトキシ)テトラヒドロピラン(3g、14.11ミリモル)、
炭酸カリウム(1.95g、14.11ミリモル)、ヨウ化ナトリウム(2g、
13.47ミリモル)及びDMF(15ml)の混合物を100℃にて3時間撹
拌した。反応液を室温に戻し、水中に注ぎ、酢酸エチルにより2回抽出した。有機相を合わせ、2回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸マグネシウムにより

10 乾燥した。濾過後、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー $(n-\alpha+\psi)$ 酢酸エチル=1/1) により精製し、無色オイルの2- $[2-(4-\mu)$ アルオロメチルフェノキシ)エトキシ] テトラヒドロピラン (2.47g、収率 66%) を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

15 1. 41-1. 90 (6H, m), 3. 45-3. 66 (1H, m), 3. 76
-3. 96 (2H, m), 4. 02-4. 24 (3H, m), 4. 63-4. 7
6 (1H, m), 6. 98 (2H, d, J=8. 6Hz), 7. 53 (2H, d, J=8. 6Hz).

参考例16

20 2- (4-トリフルオロメチルフェノキシ) エタノールの製造

参考例 15で製造した 2-[2-(4-)リフルオロメチルフェノキシ)エトキシ] テトラヒドロピラン(2.47g、8.51ミリモル)を用い、参考例 14と同様にして、白色粉末結晶の 2-(4-)リフルオロメチルフェノキシ)エタノール(1.32g、収率 79%)を得た。

 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

3. 88-4. 14 (4H, m), 6. 98 (2H, d, J=8. 6Hz), 7. 55 (2H, d, J=8. 6Hz).

参考例17

1-[2-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ) エチル] -4-(4-トリ

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 41-1. 92 (6H, m), 2. 45-2. 59 (2H, m), 2. 67
10 -2. 86 (4H, m), 3. 18-3. 31 (2H, m), 3. 43-3. 6
5 (2H, m), 3. 80-4. 00 (2H, m), 4. 55-4. 65 (1H, m), 5. 98-6. 10 (1H, m), 7. 15 (2H, dd, J=2. 1 Hz, 8. 8Hz), 7. 38 (2H, dd, J=2. 1Hz, 8. 8Hz)。
参考例18

参考例17で製造した1-[2-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)ェチル]-4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン(<math>425 mg、1.14ミリモル)を用い、参考例14と同様に

20 して、淡茶オイルの2-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イル] エタノール(222 m g、収率 68%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

2. 47-2. 59 (2H, m), 2. 68 (2H, t, J=5. 5Hz), 2. 25 79 (2H, t, J=5. 5Hz), 3. 16-3. 25 (2H, m), 3. 7 0 (2H, t, J=5. 5Hz), 6. 00-6. 10 (1H, m), 7. 17 (2H, dd, J=2. 1Hz, 6. 7Hz), 7. 40 (2H, dd, J=2. 1Hz, 6. 7Hz)

参考例19

- 3-(4-トリフルオロメチルフェニル) -2-プロピン-1-オールの製造 4-ブロモベンゾトリフルオリド(6.5g、28.89ミリモル)、プロパ ルギルアルコール(2.35ml、40.45ミリモル)、トリエチルアミン (5.64ml、40.45ミリモル)、トリフェニルホスフィン(230mg、
- 5 0.87ミリモル)、ヨウ化第一銅(110mg、0.58ミリモル)、ジクロロビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(210mg、0.29ミリモル)及びトルエン(100ml)の混合物を窒素雰囲気下、100℃にて2時間撹拌した。反応液を室温に戻し、セライト濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=9/
- 10 1) により精製し、淡茶オイルの3-(4-トリフルオロメチルフェニル) -2 -プロピン-1-オール (3.47g、収率60%) を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

4. 52 (2H, d, J=6. 2Hz), 7. 53 (2H, d, J=8. 7Hz), 7. 58 (2H, d, J=8. 7Hz).

15 参考例20

2- [N-メチル- (4-トリフルオロメトキシフェニル) アミノ] エタノール の製造

N-メチルー (4-トリフルオロメトキシフェニル) アミン (4.83g, 24.24ミリモル) 、(2-ブロモエトキシ) テトラヒドロピラン (6.1

- 20 g、29.03ミリモル)、炭酸カリウム(3.84g、27.76ミリモル) 及びDMF(20ml)の混合物を100℃にて5時間撹拌した。反応液を室温 に戻し、水中に注ぎ、酢酸エチルにより2回抽出した。有機相を合わせ、2回水 洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メ
- 25 チレン/酢酸エチル=20/1) により精製し、微黄色オイルの2-[N-メチル-(4-トリフルオロメトキシフェニル) アミノ] エタノール(3.1g、収率53%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

2. 96 (3H, s), 3. 46 (2H, t, J=5. 7Hz), 3. 81 (2

H, q, J=5.7Hz), 6. 74 (2H, d, J=8.7Hz), 7. 08 (2H, d, J=8.7Hz).

参考例21

8-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1, 4-ジオキサ-8-アザスピ 5 ロ [4.5] デカンの製造

1-ブロモー4-(トリフルオロメトキシ)ベンゼン(6.3g、26.14ミリモル)、1,4-ジオキサー8-アザスピロ [4,5] デカン(3.35ml、26.14ミリモル)、酢酸パラジウム(60mg、0.26ミリモル)、(S) -(-) -2,2-ビス(ジフェニルホスフィノ)-1,1'-ビナフチ

- 10 ル(BINAP) (244mg、0.39ミリモル)、tertーブトキシナトリウム(3.77g、39.23ミリモル)及びトルエン(50ml)の混合物を80℃にて1時間撹拌した。反応液を室温に戻し、酢酸エチル50mlを加え、濾過した。濾液を水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸マグネシムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ
- 15 一(塩化メチレン/メタノール=50/1)により精製し、微黄色粉末の8-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1,4-ジオキサー8-アザスピロ[4.5]デカン(6.54g、収率83%)を得た。

 1 H-NMR (CDC1₃) δ p p m :

1. 83 (4H, t, J=5. 8Hz), 3. 31 (4H, t, J=5. 8

20 Hz), 3. 99 (4H, s), 6. 90 (2H, d, J=8.8Hz), 7. 09 (2H, d, J=8.8Hz) $_{\circ}$

参考例22

1-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペリジン-4-オンの製造参考例21で製造した8-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1、4-25 ジオキサ-8-アザスピロ[4.5]デカン(1.23g、4.06ミリモル)、濃塩酸(5ml)、水(10ml)及びエタノール(30ml)の混合物を5時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧濃縮した。残渣に10%苛性ソーダを加え、塩化メチレンにより抽出した。水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸マグネシムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカ

ラムクロマトグラフィー $(n-\wedge + \forall \nu)$ 酢酸エチル= 3/1) により精製し、 無色オイルの1-(4-) リフルオロメトキシフェニル) ピペリジン-4- オン $(848 \, \mathrm{mg} \, \mathrm{v} \, \mathrm{v$

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

5 2. 56 (4H, t, J=6. 2Hz), 3. 59 (4H, t, J=6. 2 Hz), 6. 94 (2H, d, J=8. 5Hz), 7. 14 (2H, d, J=8. 5Hz).

参考例23

- 1-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペリジン-4-オールの製造
- 10 参考例22で製造した1-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペリジン-4-オン(1.11g、4.28ミリモル)及びメタノール(30ml)の混合物に、氷冷下にて水素化ホウ素ナトリウム(324mg、8.56ミリモル)を加え、同温度下にて30分撹拌した。反応液に10%塩酸を加え、減圧下にて濃縮した。残渣に飽和重曹水を加え、塩化メチレンにより抽出した。抽出溶液を
- 15 水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸マグネシムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン / 酢酸エチル= 3 / 1)により精製し、白色粉末の1-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペリジンー4-オール(1.08g、収率97%)を得た。 1 H-NMR(CDC 1_{2}) δ p p m:
- 20 1. 59-1. 76 (2H, m), 1. 90-2. 06 (2H, m), 2. 82
 -2. 98 (2H, m), 3. 43-3. 57 (2H, m), 3. 75-3. 9
 1 (1H, m), 6. 89 (2H, d, J=7. 1Hz), 7. 09 (2H, d, J=7. 1Hz).

参考例23と同様にして、参考例24及び参考例25の化合物を製造した。

25 参考例 2 4

1-(4-トリフルオロメチルフェニル) ピペリジン-4-オール 白色粉末、収率76%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 53-1. 71 (2H, m), 1. 89-2. 04 (2H, m), 2. 91

 $-3.\ 11\ (2H, m)$, $3.\ 56-3.\ 71\ (2H, m)$, $3.\ 80-4.\ 0$ $0\ (1H, m)$, $6.\ 93\ (2H, d, J=8.\ 7Hz)$, $7.\ 46\ (2H, d, J=8.\ 7Hz)$.

参考例25

5 1-(4-メトキシフェニル) ピペリジン4-オール 白色粉末、収率5%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 64-1. 79 (2H, m), 1. 92-2. 08 (2H, m), 2. 74
-2. 88 (2H, m), 3. 32-3. 47 (2H, m), 3. 70-3. 8

10 5 (4H, m), 6.84 (2H, dd, J=2.4Hz, 6.8Hz), 6. 93 (2H, dd, J=2.4Hz, 6.8Hz),

参考例26

20

- 1- (4-クロロフェニル) ピペリジン-4-オールの製造
- 15 デカン (2.6g、10.25ミリモル)、濃塩酸 (12m1)、水 (10m1)及びエタノール (50m1)の混合物を5時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧濃縮した。残渣に10%苛性ソーダを加え、塩化メチレンにより抽出した。水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸マグネシムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧濃縮した。この残渣をメタノール (50m1) に溶解し、氷
 - 冷下にて水素化ホウ素ナトリウム(388mg、10.25ミリモル)を加え、 同温度下にて30分撹拌した。反応液に10%塩酸を加え、減圧下にて濃縮した。 残渣に飽和重曹水を加え、塩化メチレンにより抽出した。水洗後、飽和食塩水に より洗浄し、硫酸マグネシムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧濃縮した。残 渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=3/
- 25 1) により精製し、微黄色粉末結晶の1-(4-クロロフェニル) ピペリジン-4-オール (1.73g、収率80%) を得た。
 - ¹H-NMR (CDCl₃) δppm:
 - 1. 55-1. 74 (2H, m), 1. 89-2. 08 (2H, m), 2. 79 -3. 00 (2H, m), 3. 43-3. 57 (2H, m), 3. 75-3. 9

2 (1H, br), 6.89 (2H, d, J=7.1Hz), 7.09 (2H, d, J=7.1Hz),

対応する出発原料を用い、参考例26と同様にして、参考例27の化合物を製造した。

5 参考例27

1- (4-フルオロフェニル) ピペリジン-4-オール 白色粉末、収率66%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 57-1. 79 (2H, m), 1. 92-2. 08 (2H, m), 2. 75

10 -2. 92 (2H, m), 3. 36-3. 50 (2H, m), 3. 74-3. 8

9 (1H, m), 6. 77-7. 00 (4H, m).

参考例28

4- [4-(tert-ブチルジメチルシロキシ) ピペリジン-1-イル] ベン ゾニトリルの製造

- 4-ブロモベンゾニトリル (2.76g、15.16ミリモル)、4- (tert-ブチルジメチルシロキシ) ピペリジン (2.9g、13.79ミリモル)、酢酸パラジウム (62mg、0.28ミリモル)、(S)-(-)-2,2'-ビス (ジフェニルホスフィノ)-1,1'-ビナフチル (BINAP) (258mg、0.41ミリモル)、tert-ブトキシナトリウム (1.99)
- 20 g、20.68ミリモル)及びトルエン(60ml)の混合物を80℃にて1時間撹拌した。反応液を室温に戻し、酢酸エチル60mlを加え、濾過した。濾液を水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸マグネシムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(nーヘキサン/塩化メチレン=1/1)により精製し、微黄色粉末結晶の4-[4-
- 25 (tertーブチルジメチルシロキシ) ピペリジン-1-イル] ベンゾニトリル (2. 8g、収率66%) を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

0. 90 (9H, s), 1. 50-1. 69 (8H, m), 1. 73-1. 90 (2H, m), 3. 18-3. 31 (2H, m), 3. 50-3. 65 (2H,

m), 3. 90-4. 04 (1 H, m), 6. 85 (2 H, d, J=7. 0 Hz), 7. 47 (2 H, d, J=7. 0 Hz).

参考例29

4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンゾニトリルの製造

- 5 参考例28で製造した4-[4-(tert-ブチルジメチルシロキシ)ピペリジン-1-イル]ベンゾニトリル(2.8g、8.85ミリモル)及びTHF(30ml)の混合物に、氷冷下にて1Mテトラn-ブチルアンモニウムフロリドのTHF溶液(10.6ml、10.2ミリモル)を加え、室温下にて16時間撹拌した。反応液を減圧下にて濃縮した。残渣に水を加え、酢酸エチルにより
- 10 2回抽出した。有機相を合わせ、水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(nーヘキサン/酢酸エチル=1/2)により精製し、白色粉末結晶の4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンゾニトリル(1.52g、収率85%)を得た。
- 15 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1. 50-1. 73 (2H, m), 1. 90-2. 04 (2H, m), 3. 00 -3. 20 (2H, m), 3. 59-3. 76 (2H, m), 3. 84-4. 04 (1H, m), 6. 86 (2H, dd, J=2. 0Hz, 7. 1Hz), 7. 48 (2H, dd, J=2. 0Hz, 7. 1Hz)

20 参考例30

1-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペリジン-4-カルボン酸エチルエステルの製造

4-ブロモベンゾトリフルオリド(3. 15g、13. 99ミリモル)及びイソニペコチン酸エチル(2. 2g、13. 99ミリモル)を用い、参考例 21と

25 同様にして、淡茶粉末結晶の1-(4-トリフルオロメチルフェニル) ピペリジン-4-カルボン酸エチルエステル(3.18g、収率74%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 27 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 71-2. 10 (4H, m), 2. 41-2. 55 (1H, m), 2. 82-2. 98 (2H, m), 3. 65-3.

参考例32

20

80 (2H, m), 4. 16 (2H, q, J=7. 2Hz), 6. 92 (2H, d, J=6. 9Hz), 7. 63 (2H, d, J=6. 9Hz)。 参考例31

[1-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペリジン-4-イル]メタノール 5 の製造

水素化リチウムアルミニウム(1.58g、41.64ミリモル)をTHF (30m1)に懸濁し、窒素雰囲気下、氷冷下にて参考例30で製造した1ー (4ートリフルオロメチルフェニル)ピペリジンー4ーカルボン酸エチルエステル(3.18g、10.41ミリモル)をTHF (10m1)に溶解した溶液を10 滴下した。同温度下にて30分撹拌した。反応液に水、10%苛性ソーダを加え、セライト濾過した。濾液から酢酸エチルにより2回抽出した。有機相を合わせ、水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧濃縮し、微黄色オイルの[1-(4ートリフルオロメチルフェニル)ピペリジンー4ーイル]メタノール(2.64g、収率98%)を得た。

- 15 ¹H-NMR (CDCl₃) δ p p m:
 1. 31-1. 47 (2H, m), 1. 61-1. 90 (3H, m), 2. 74
 -2. 90 (2H, m), 3. 45-3. 61 (2H, m), 3. 83 (2H, d, J=12. 6Hz), 6. 92 (2H, d, J=8. 8Hz), 7. 46
 (2H, d, J=8. 8Hz)
- 1-(4-トリフルオロメトキシベンジル)ピペリジン-4-オールの製造
 4-(トリフルオロメトキシ)ベンズアルデヒド(1g、5.26ミリモル)、
 4-ヒドロキシピペリジン(798mg、7.89ミリモル)及びアセトニトリル(20m1)の混合物に、氷冷下にてトリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム
 (1.67g、7.89ミリモル)を加え、同温度下にて30分撹拌後、室温下にて終夜撹拌した。反応液を7.5%重曹水中に注ぎ、酢酸エチルにより2回抽出した。有機相を合わせ、水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムに

より乾燥した。濾過後、濾液を減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマト

グラフィー(塩化メチレン/メタノール=10/1)により精製し、微黄色オイ

u01- (4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペリジン-4-オール (1. 21g、収率84%) を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 50-1. 74 (2H, m), 1. 80-1. 98 (2H, m), 2. 08

5 -2. 24 (2H, m), 2. 63-2. 84 (2H, m), 3. 49 (2H, s), 3. 61-3. 80 (1H, m), 7. 15 (2H, d, J=8. 5 Hz), 7. 34 (2H, d, J=8. 5Hz).

参考例32と同様にして、参考例33及び実施例34の化合物を製造した。 参考例33

10 1-(4-クロロベンジル) ピペリジン-4-オール 白色粉末、収率87%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 48-1. 63 (2H, m), 1. 76-1. 91 (2H, m), 2. 04 -2. 20 (2H, m), 2. 61-2. 76 (2H, m), 3. 45 (2H,

15 s), 3. 57-3. 72 (1H, m), 7. 24 (2H, d, J=8. 8 Hz), 7. 28 (2H, d, J=8. 8Hz).

参考例34

1-(4-トリフルオロメチルベンジル)ピペリジン-4-オール 白色粉末、収率83%

- 20 ¹H-NMR (CDCl₃) δ p p m: 1. 43-1. 67 (2H, m), 1. 80-1. 94 (2H, m), 2. 06 -2. 24 (2H, m), 2. 63-2. 78 (2H, m), 3. 67 (2H, s), 3. 61-3. 72 (1H, m), 7. 44 (2H, d, J=8. 0 Hz), 7. 57 (2H, d, J=8. 0 Hz).
- 25 参考例35

(4-ベンジルピペラジン-1-イル) カルバミン酸 t e r t - ブチルエステル の製造

4-ベンジルピペラジンー1-イルアミン (36.03g、188ミリモル) をメタノール (260ml) に溶解し氷冷した。二炭酸ジー tertーブチル

- (61.66g、283ミリモル)をメタノール (100m1) に溶解した溶液を20分で滴下した。室温に戻し終夜で撹拌した。反応液を濃縮後、シリカゲルカラムクログラフィー (nーヘキサン/アセトン=3/1) により精製した。得られた固体にイソプロピルエーテル (IPE) (60m1) 及びnーヘキサン (20m1)を加え、攪拌後濾過し、一次晶を得た。母液を濃縮し、イソプロピルエーテル (10m1) 及びnーヘキサン (10m1)を加え、攪拌後濾過し、二次晶を得た。一次晶と二次晶をあわせて減圧乾燥し、白色粉末結晶の (4ーベンジルピペラジン-1ーイル) カルバミン酸 tertーブチルエステル (42.2g、収率77%)を得た。
- 10 ¹H-NMR (CDCl₃) δppm:
 1. 45 (9H, s), 2. 55-2. 58 (4H, m), 2. 80 (4H, br), 3. 51 (2H, s), 5. 35 (1H, br), 7. 24-7. 31 (5H, m)。
 参考例36
- 15 ピペラジン-1-イルカルバミン酸 t e r t ブチルエステルの製造 参考例 3 5 で製造した (4 ベンジルピペラジン-1-イル) カルバミン酸 t e r t ブチルエステル (42.22g、145ミリモル) をエタノール (300ml) に溶解した。20%水酸化パラジウム/炭素 (6.0g) を加え、水素雰囲気下室温で20分撹拌し、更に50℃で30分撹拌した。20%水酸化パラジウム/炭素をセライトで濾去した後、濾液を減圧濃縮した。得られた固体を I P E で洗浄し濾過した。得られた固体を減圧乾燥し、白色粉末結晶のピペラジン-1-イルカルバミン酸 t e r t ブチルエステル (28.9g、収率99%) を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

25 1.46 (9H, s), 2.74-2.77 (4H, m), 2.95-2.99 (4H, m), 5.45 (1H, br)。 参考例37

4-[4-(トリフルオロメチル) フェノキシ] ピペリジン<math>-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

- 10 ル (1.13g、収率44%) を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 48 (9H, s), 1. 65-1. 82 (2H, m), 1. 87-1. 97 (2H, m), 3. 34-3. 44 (2H, m), 3. 63-3. 74 (2H, m), 4. 47-4. 58 (1H, m), 6. 89-6. 97 (2H, m), 7.

15 47-7. 55 (2H, m).

参考例38

4- (4-トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジンの製造

- 20 を塩化メチレン(10ml)に溶解した。室温下トリフルオロ酢酸(10ml)を滴下して加え、5時間撹拌した。反応液を減圧濃縮後、残渣を再び塩化メチレンに溶解した。塩化メチレン溶液を水酸化ナトリウム水溶液でアルカリ性とし、塩化メチレンで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮して、白色粉末の4-(4-トリフル25 オロメチルフェノキシ)は8.8 リンド・イ
- 25 オロメチルフェノキシ)ピペリジン(727mg、収率91%)を得た。 ^1H-NMR (CDCl $_9$) δ p p $_m$:

1. 63-1. 75 (2H, m), 1. 97-2. 06 (2H, m), 2. 69
-2. 80 (2H, m), 3. 10-3. 20 (2H, m), 4. 38-4. 4
9 (1H, m), 6. 94-6. 98 (2H, m), 7. 50-7. 55 (2H,

m)。

対応する出発原料を用い、参考例38と同様の方法により、参考例39~参考例43の化合物を製造した。

参考例39

5 4- (4-フルオロフェノキシ) ピペリジン

白色粉末、収率76%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 61-1. 74 (2H, m), 1. 96-2. 06 (2H, m), 2. 50 (1H, bs), 2. 70-2. 80 (2H, m), 3. 11-3. 20 (2H,

10 m), 4. 23-4. 33 (1H, m), 6. 80-6. 89 (2H, m), 6. 91-7. 00 (2H, m).

参考例40

4- (3-トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジン

白色粉末、収率48%

- 15 ¹H-NMR (CDCl₃) δ p p m:
 1. 62-1. 76 (2H, m), 1. 80 (1H, bs), 1. 97-2. 0
 8 (2H, m), 2. 71-2. 81 (2H, m), 3. 11-3. 20 (2H, m), 4. 37-4. 47 (1H, m), 7. 05-7. 20 (3H, m), 7.
- 20 参考例 4 1

4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)ピペリジン

白色粉末、収率88%

34-7.41(1H, m)

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 59-1.73 (3H, m), 1. 97-2.04 (2H, m), 2. 68

25 -2. 78 (2H, m), 3. 10-3. 19 (2H, m), 4. 29-4. 3 6 (1H, m), 6. 85-6. 92 (2H, m), 7. 10-7. 14 (2H, m),

参考例42

4-(4-シアノフェノキシ)ピペリジン

白色粉末、収率83%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 63-1. 77 (3H, m), 1. 98-2. 08 (2H, m), 2. 72
-2. 82 (2H, m), 3. 12-3. 21 (2H, m), 4. 42-4. 5

5 1 (1H, m), 6. 92-6. 98 (2H, m), 7. 55-7. 61 (2H, m).

参考例43

4-(4-クロロフェノキシ) ピペリジン

白色粉末、収率62%

10 ¹H-NMR (CDCl₃) δppm:
1. 50 (1H, bs), 1. 56-1. 71 (2H, m), 1. 94-2. 0
4 (2H, m), 2. 66-2. 76 (2H, m), 3. 08-3. 18 (2H, m), 4. 25-4. 35 (1H, m), 6. 80-6. 86 (2H, m), 7. 18-7. 25 (2H, m)。

15 参考例 4 4

1-エチル-5-(3-メチル-3-ブテニル)-1H-テトラゾールの製造
 1-エチル-5-メチル-1H-テトラゾール(0.80g、7.13ミリモル)のTHF(15ml)溶液に-70℃に冷却攪拌下、n-ブチルリチウム(1.53M)へキサン溶液(6.5ml、9.98ミリモル)を滴下して1.

- 20 5時間攪拌し、同温で3-クロロー2-メチルー1-プロペン(0.77ml、7.84ミリモル)のTHF(5ml)溶液を加え、更に同温で2時間攪拌した。反応混合液に水を加え、酢酸エチルで抽出して硫酸マグネシムで乾燥後、減圧濃縮した。茶色液体の1-エチルー5-(3-メチルー3-ブテニル)-1H-テトラゾール(0.95g、収率80%)を得た。
- 25 ¹H-NMR (CDCl₃) δ p p m: 1. 56 (3H, t, J=7. 3Hz), 1. 80 (3H, s), 2. 44-2. 67 (2H, m), 2. 90-3. 06 (2H, m), 4. 32 (2H, q, J =7. 3Hz), 4. 65-4. 77 (1H, m), 4. 77-4. 87 (1H, m).

対応する出発原料を用い、参考例44と同様にして、参考例45及び46の化 合物を製造した。

参考例45

1-フェニル-5-(3-メチル-3-ブテニル)-1H-テトラゾール

5 白色粉末、収率45%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 67 (3H, s), 2. 49 (2H, t, J=8. 1Hz), 3. 04 (2H, t, J=8. 1Hz), 4. 58-4. 65 (1H, m), 4. 71-4. 77 (1H, m), 7. 43-7. 47 (2H, m), 7. 59-7. 62 (3

10 H, m) .

参考例46

1-(4-)000フェニル)-5-(3-メチル-3-ブテニル)-1 H-テトラゾール

白色粉末、収率55%

15 ¹H-NMR (CDCl₃) δ p p m:
1. 68 (3H, s), 2. 50 (2H, t, J=8. 1Hz), 3. 03 (2 H, t, J=8. 1Hz), 4. 58-4. 63 (1H, m), 4. 71-4.
77 (1H, m), 7. 38-7. 44 (2H, m), 7. 56-7. 62 (2

H, m) 。

20 参考例 4 7

3- (4-メチル-4-ペンテニル) -3H-ベンゾオキサゾール-2-オンの 製造

メチルトリフェニルホスホニウムブロミド(11g、30.8ミリモル)及び THF(<math>100m1)の混合物に、氷冷下にてtertーブトキシカリウム(3.

25 5g、31.2ミリモル)を徐々に加え、同温度下にて20分撹拌した。同温度下にて3-(4-オキソペンチル)-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン(5.6g、25.6ミリモル)をTHF(10ml)に溶解した溶液を徐々に滴下して加えた。室温下にて2時間撹拌した。反応液を氷水中に注ぎ、酢酸エチルにより2回抽出した。有機相を合わせ、水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウ

ムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー $(n-\alpha+ + \nu)$ 酢酸エチル= 3/1) により精製し、無色オイルの3- $(4-\lambda + \nu)$ - $3H-\alpha + \nu$ - $3H-\alpha$

- 5 ¹H-NMR (CDCl₃) δppm:
 1.73 (3H, s), 1.84-2.16 (4H, m), 3.83 (2H, t, J=7.3Hz), 4.75 (2H, d, J=12.7Hz), 6.97 (1H, d, J=8.2Hz), 7.02-7.28 (3H, m)。
 参考例48
- 10 3-(5-メチル-5-ヘキセニル) 3 H ベンゾオキサゾール-2-オンの 製造

3-(5-オキソヘキシル)-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン(1.4g、6ミリモル)を用い、参考例47と同様にして、無色オイルの<math>3-(5-メチル-5-ヘキセニル)-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン(1.1g、収率79%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 42-1. 60 (2H, m), 1. 65-1. 83 (5H, m), 2. 00
-2. 16 (2H, m), 3. 84 (2H, t, J=6. 9Hz), 4. 69
(2H, d, J=11. 7Hz), 6. 97 (1H, d, J=7. 9Hz), 7.
02-7. 23 (3H, m)

参考例49

15

20

5-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-3 H-[1, 3, 4] オキサジア ゾールー2 - オンの製造

4ートリフルオロメトキシ安息香酸ヒドラジド (5.06g、22.98ミリ 25 モル)のTHF (150ml)溶液に氷冷攪拌下、トリエチルアミン (3.52 ml、25.28ミリモル)及び1,1'ーカルボニルジイミダゾール (4.8 4g、29.87ミリモル)を加え、室温で2時間攪拌した。減圧濃縮し、水を加え、酢酸エチルで抽出し、硫酸マグネシムで乾燥後、減圧濃縮した。白色固体の5-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-3H-[1,3,4]オキサジ

アゾール-2-オン(5.34g、収率94%)を得た。

1H-NMR (DMSO-d6) δppm :

7. 01 (1H, s), 7. 47-7. 59 (2H, m), 7. 86-7. 98 (2H, m).

5 対応する出発原料を用い、参考例49と同様にして、参考例50~参考例61 の化合物を製造した。

参考例50

5-(4-)リフルオロメチルフェニル)-3H-[1, 3, 4]オキサジアゾール-2-オン

10 白色粉末、収率 9 7%

 1 H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

7. 90 (2H, d, J=8.5Hz), 7. 99 (2H, d, J=8.5Hz).

参考例51

15 5-(4-ビフェニリル)-3H-[1, 3, 4]オキサジアゾール-2-オン 白色粉末、収率97%

 1 H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

7. 35-7. 52 (3H, m), 7. 68-7. 73 (2H, m), 7. 76 -7. 87 (4H, m).

20 参考例 5 2

5-フェニル-3H-[1, 3, 4] オキサジアゾール-2-オン 白色粉末、収率92%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

7. 40-7. 58 (3H, m), 7. 77-7. 91 (2H, m)

25 参考例 5 3

5- (4-クロロフェニル) -3H-[1, 3, 4] オキサジアゾール-2-オン

白色粉末、収率80%

 $^{1}H-NMR$ (DMSO-d₆) δ p p m:

470

7. 61 (2H, dd, J=1. 9Hz, 6. 6Hz), 7. 80 (2H, dd, J=1. 9Hz, 6. 6Hz).

参考例54

5- (4-フルオロフェニル) -3H-[1, 3, 4] オキサジアゾール-2-

5 オン

白色粉末、収率74%

 1 H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

7. 30-7. 49 (2H, m), 7. 78-7. 92 (2H, m)。 参考例55

10 5-(4-プロモフェニル) <math>-3H-[1, 3, 4] オキサジアゾールー2-オン

白色粉末、収率87%

 1 H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

7. 65-7. 78(4H, m).

15 参考例 5 6

5-(4-クロロベンジル) - 3 H - [1, 3, 4] オキサジアゾールー<math>2-オン

白色粉末、収率83%

 1 H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

20 3. 94 (2H, s), 7. 31 (2H, dd, J=2. 1Hz, 6. 4Hz), 7. 41 (2H, dd, J=2. 1Hz, 6. 4Hz).

参考例 5 7

5-[2-(4-クロロフェニル) エチル]-3H-[1,3,4] オキサジア ゾールー2-オン

25 白色粉末、収率78%

 1 H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

2. 76-3.00 (4H, m), 7. 27 (2H, d, J=8.5Hz), 7.

35 (2H, d, J=8.5Hz), 12.03 (1H, s)

参考例58

5-(4-クロロスチリル) - 3H-[1, 3, 4] オキサジアゾールー<math>2-オン

白色粉末、収率88%

 $^{1}H-NMR$ (DMSO-d₆) δ ppm:

5 6. 99 (1H, d, J=16. 5Hz), 7. 32 (1H, d, J=16. 5 Hz), 7. 47 (2H, d, J=8. 6Hz), 7. 75 (2H, d, J=8. 6Hz), 12. 06 (1H, s).

参考例59

5-(4-クロロフェノキシメチル)-3H-[1,3,4]オキサジアゾール

10 -2-オン

白色粉末、収率68%

 $^{1}H-NMR$ (DMSO-d₆) δ ppm:

5. 07 (2H, s), 7. 07 (2H, d, J=6. 8Hz), 7. 37 (2H, d, J=6. 8Hz), 12. 41 (1H, br).

15 参考例60

5-(4-ピリジル)-3 H-[1,3,4] オキサジアゾールー2-オン 白色粉末、収率4.0%

 1 H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

7. 72 (2H, dd, J=1. 6Hz, 4. 6Hz), 8. 76 (2H, dd,

20 J=1.6Hz, 4.6Hz), 12.90(1H, s).

参考例61

5-(2-ピリミジル)-3 H-[1,3,4] オキサジアゾールー2-オン 白色粉末、収率7.0%

¹H-NMR (DMSO-d₆) δppm:

25 8. 68-8. 86 (2H, m), 9. 12 (1H, d, J=1. 4Hz), 1 2. 97 (1H, s).

参考例62

(S) -2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシメチル)ピロリジン-1-カルボン酸 t e r t -ブチルエステルの製造

- 4-(トリフルオロメトキシ) フェノール(2. 1 g、1 1. 8 ミリモル)、(S)-2-ヒドロキシメチルピロリジン-1-カルボン酸 t e r t -ブチルエステル(2 g、9. 8 ミリモル)、アゾジカルボン酸ジエチル(2. 3 m 1、14. 7 ミリモル)、トリフェニルホスフィン(3. 8 6 g、1 4. 7 ミリモル)
- 5 及びTHF(30ml)の混合物を1時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=10/1)により精製し、微黄色オイルの(S)-2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシメチル)ピロリジン-1-カルボン酸tertーブチルエステル(2.96g、収率65%)を得た。
- 10 ¹H-NMR (CDCl₃) δ p p m:
 1. 48 (9H, s), 1. 78-2. 10 (4H, m), 3. 27-3. 49 (2H, m), 3. 73-3. 98 (1H, m), 4. 04-4. 20 (2H, m), 6. 90 (2H, dd, J=2. 2Hz, 7. 0Hz), 7. 12 (2H, dd, J=2. 2Hz, 7. 0Hz).
- 15 参考例 6 3
 - (S) -2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシメチル)ピロリジンの製造 参考例 62で製造した(S) -2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシメ チル)ピロリジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル(2.31g、6.39ミリモル)、トリフルオロ酢酸(20m1)及び塩化メチレン(20m1)
- 20 の混合物を室温下にて4時間撹拌した。反応液を減圧下にて濃縮した。残渣に10%苛性ソーダを加え塩基性とし、塩化メチレンにより抽出し、硫酸マグネシムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧濃縮し、淡茶オイルの(S)-2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシメチル)ピロリジン(1.65g、収率99%)を得た。
- 25 ¹H-NMR (CDCl₃) δppm: 1. 45-1. 63 (1H, m), 1. 65-2. 04 (3H, m), 2. 70 (1H, bs), 2. 88-3. 08 (2H, m), 3. 43-3. 59 (1H, m), 3. 78-3. 96 (2H, m), 6. 88 (2H, dd, J=2. 3 Hz, 8. 4Hz), 7. 11 (2H, dd, J=2. 3Hz, 8. 4Hz)。

参考例64

3-オキソー4-(4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン-1-カルボン酸 te r t-ブチルエステルの製造

3ーオキソピペラジン-1ーカルボン酸 t e r t ーブチルエステル (4.1g、5 20.4ミリモル)及びDMF (30ml)の混合物に、氷冷下にて水素化ナトリウム (840mg、24.5ミリモル)を徐々に加え、室温下にて30分撹拌した。4ートリフルオロメチルベンジルクロリド (5g、20.9ミリモル)をDMF (5ml)に溶解した溶液を氷冷下にて滴下し、室温下にて2時間撹拌した。反応液を氷水中に注ぎ、酢酸エチルにより2回抽出した。有機相を合わせ、

- 10 2回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。濾過後、 濾液を減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレ ン)により精製し、白色粉末結晶の3-オキソー4-(4-トリフルオロメチル ベンジル)ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(6.7g、 収率91%)を得た。
- 15 ¹H-NMR (CDCl₃) δppm:
 1. 47 (9H, s), 3. 27 (2H, t, J=5.7Hz), 3. 62 (2H, t, J=5.7Hz), 4. 18 (2H, s), 4. 67 (2H, s), 7. 39 (2H, d, J=8.1Hz), 7. 61 (2H, d, J=8.1Hz)。
 参考例65
- 20 1-(4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン-2-オンの製造 参考例64で製造した3-オキソ-4-(4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(6.7g、18.7ミリモル)を用い、参考例63と同様にして、微黄色粉末の1-(4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン-2-オン(4.5g、収率93%)を得た。
- 25 ¹H-NMR (CDCl₃) δppm:
 3. 06 (2H, t, J=5. 2Hz), 3. 24 (2H, t, J=5. 2
 Hz), 3. 62 (2H, s), 4. 60 (2H, s), 7. 39 (2H, d,
 J=8. 1Hz), 7. 59 (2H, d, J=8. 1Hz)。
 参考例66

4'ートリフルオロメトキシビフェニルー4ーカルボアルデヒドの製造

1-プロモー4- (トリフルオロメトキシ) ベンゼン (1.53g、6.35 ミリモル)、4-ホルミルベンゼンボロン酸 (1g、6.67ミリモル)、テトラキストリフェニルホスフィンパラジウム(147mg、0.13ミリモル)、

- 5 リン酸カリウム(2.02g、9.53ミリモル)及びDMF(10m1)の混合物を100℃にて5時間撹拌した。反応液を室温に戻し、酢酸エチルにより抽出し、3回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/塩化メチレン=3/1)により精製し、白色粉末の4'-トリ
- 10 フルオロメトキシビフェニルー4ーカルボアルデヒド(1.56g、収率92%)を得た。

 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

7. 33 (2H, d, J=8.8Hz), 7. 60-7. 80 (4H, m), 7. 97 (2H, d, J=8.2Hz), 10. 07 (1H, s).

15 参考例66と同様にして、対応するヨードベンゼン又は臭化ベンゼン化合物と ホルミルベンゼンボロン酸から参考例67~参考例73の化合物を製造した。

参考例67

4'-トリフルオロメチルビフェニルー4ーカルボアルデヒド 無色粉末晶、収率27%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:
 7. 68-7. 81 (6H, m), 7. 99 (2H, dd, J=1. 7Hz, 6. 5Hz), 10. 09 (1H, s).

参考例 6 8

4, -トリフルオロメチルビフェニル-3-カルボアルデヒド

25 黄色オイル、収率83%

 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

7. 33 (2H, d, J=8.8Hz), 7. 60-7. 80 (4H, m), 7. 97 (2H, d, J=8.2Hz), 10. 07 (1H, s).

参考例69

4, -ジメチルアミノビフェニル-4-カルボアルデヒド

黄色粉末、収率46%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

3. 03 (6H, s), 6. 81 (2H, dd, J=2. 1Hz, 6. 8Hz),

5 7. 58 (2H, dd, J=2. 1Hz, 6. 8Hz), 7. 71 (2H, dd, J=1. 8Hz, 6. 6Hz), 7. 90 (2H, dd, J=1. 8Hz, 6.

6Hz), 10.00(1H, s).

参考例70

4'ークロロビフェニルー4ーカルボアルデヒド

10 微黄色粉末結晶、収率47%

 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm: 7. 45 (2H, d, J=8. 6Hz), 7. 57 (2H, d, J=8. 6

Hz), 7. 73 (2H, d, J=8. 4Hz), 7. 96 (2H, d, J=8.

 $4\,H\,z$), 10.06(1H, s).

15 参考例71

2'-クロロビフェニルー4-カルボアルデヒド

白色粉末結晶、収率46%

 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

7. 30-7. 40 (3H, m), 7. 38-7. 58 (1H, m), 7. 63

20 (2H, d, J=8.1Hz), 7. 96 (2H, d, J=8.1Hz), 10. 08 (1H, s).

参考例72

3', 4'ージクロロビフェニルー4ーカルボアルデヒド

白色粉末結晶、収率24%

 25 $^{1}H-NMR$ (CDCl₃) δ ppm:

7. 46 (1H, dd, J=2. 1Hz, 8. 4Hz), 7. 56 (1H, d,

J=8.4Hz), 7.70-7.80 (3H, m), 7.97 (2H, dd,

J=1.8Hz, 6.6Hz), 10.07 (1H, s).

参考例73

4'ーメトキシビフェニルー4ーカルボアルデヒド

白色粉末結晶、収率45%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

3. 87 (3H, s), 7. 01 (2H, d, J=6. 8Hz), 7. 59 (2 5 H, d, J=6. 8Hz), 7. 72 (2H, d, J=8. 3Hz), 7. 93 (2H, d, J=8. 3Hz), 10. 04 (1H, s).

参考例74

4-ピリジン-3-イル-ベンズアルデヒドの製造

4ーブロモベンズアルデヒド(2g、10.8ミリモル)、ジエチル(3ーピ 10 リジル)ボラン(1.75g、11.9ミリモル)、テトラキス(トリフェニル ホスフィン)パラジウム(375mg、0.32ミリモル)、2Nー炭酸ナトリウム(10.8ml、21.6ミリモル)及びトルエン(40ml)の混合物を 窒素雰囲気下にて、終夜加熱還流した。反応液を室温に戻し、酢酸エチルにより 希釈した。水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。

15 濾過後、濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=1/1)により精製し、微黄色粉末結晶の4-(ピリジン-3-イル)ベンズアルデヒド(1.43g、収率72%)を得た。
¹H-NMR(CDCl₃)δppm:

7. 33-7. 50 (1H, m), 7. 76 (2H, dd, J=1. 8Hz, 6. 20 6Hz), 7. 89-8. 06 (3H, m), 8. 56-8. 69 (1H, m), 8. 90 (1H, dd, J=0. 7Hz, 1. 7Hz), 10. 09 (1H, s).

参考例75

4- (イミダゾール-1-イル) ベンズアルデヒドの製造

4-フルオロベンズアルデヒド(4.96g、40ミリモル)、イミダゾール(2.86g、42ミリモル)、炭酸カリウム(6.08g、44ミリモル)及びDMSO(40ml)の混合物を110℃にて終夜撹拌した。反応液を室温に戻し、氷水(100ml)中に注ぎ、析出晶を濾取した。水洗後、酢酸エチルにより洗浄し、微黄色粉末結晶の4-(イミダゾール-1-イル)ベンズアルデヒ

ド(2.33g、収率34%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

7. 20-7. 30 (1 H, m), 7. 38 (1 H, dd, J=1. 3 Hz, 1. 4 Hz), 7. 58 (2 H, dd, J=1. 8 Hz, 6. 8 Hz), 7. 98-8. 10 (3 H, m), 10. 05 (1 H, s)

対応する出発原料を用い、参考例75と同様にして、参考例76の化合物を製造した。

参考例76

5

4- (ピペリジン-1-イル) ベンズアルデヒド

10 黄色粉末結晶、収率46%

率87%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 58-1. 75 (6H, m), 3. 33-3. 50 (4H, m), 6. 89 (2H, dd, J=1. 9Hz, 7. 0Hz), 7. 73 (2H, dd, J=1. 9Hz, 7. 0Hz), 9. 75 (1H, s).

15 参考例 7 7

4- (4-トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン-1-カルボン酸 t e r t - ブチルエステルの製造

4ーブロモベンゾトリフルオリド(3.0g、13.3ミリモル)、ピペラジンー1ーカルボン酸tertーブチルエステル(2.9g、15.3ミリモル)、20 ビス(ジベンジリデンアセトン)パラジウム(306mg、0.53ミリモル)、トリーoートリルホスフィン(162mg、0.53ミリモル)及びtertーブトキシナトリウム(2.2g、22.7ミリモル)を窒素雰囲気下トルエン(60ml)中にて4時間加熱還流した。反応液に酢酸エチル、水を加え撹拌して沈殿物をセライト濾過により除去した後、濾液を酢酸エチルで抽出した。有機25 相を飽和食塩水で洗浄し硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(nーヘキサン/塩化メチレン=2/1)により精製し、白色粉末の4-(4ートリフルオロメチルフェニル)ピペラジン-1ーカルボン酸tertーブチルエステル(3.8g、収

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 49 (9H, s), 3. 21-3. 26 (4H, m), 3. 56-3. 61 (4H, m), 6. 90-6. 93 (2H, m), 7. 47-7. 51 (2H, m).

5 対応する出発原料を用い、参考例77と同様にして、参考例78~参考例84 の化合物を製造した。

参考例78

4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペラジン-1-カルボン酸 t e r t - ブチルエステル

10 白色粉末、収率95%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 48 (9H, s), 3. 09-3. 13 (4H, m), 3. 55-3. 60 (4H, m), 6. 87-6. 91 (2H, m), 7. 10-7. 14 (2H, m).

15 参考例79

4- (4-ビフェニリル) ピペラジン-1-カルボン酸 tertーブチルエステル

白色粉末、収率95%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

20 1. 49 (9H, s), 3. 16-3. 21 (4H, m), 3. 58-3. 62 (4H, m), 6. 97-7. 01 (2H, m), 7. 27-7. 32 (1H, m), 7. 37-7. 44 (2H, m), 7. 50-7. 58 (4H, m)。 参考例80

4- (4-ジメチルアミノフェニル) ピペラジン-1-カルボン酸 t e r t - ブ

25 チルエステル

白色粉末、収率79%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 48 (9H, s), 2. 87 (6H, s), 2. 96-3. 00 (4H,

m), 3. 54-3. 59, (4H, m), 6. 72-6. 77 (2H, m),

6. 87-6. 92 (2H, m).

参考例81

4-(3-ピリジル) ピペラジン-1-カルボン酸 tert ーブチルエステル 白色粉末、収率 9.9%

5 ¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 49 (9H, s), 3. 14-3. 19 (4H, m), 3. 57-3. 62 (4H, m), 7. 17-7. 19 (2H, m), 8. 12-8. 14 (1H, m), 8. 31-8. 33 (1H, m).

参考例82

10 4-(4-x)キシカルボニルフェニル)ピペラジン-1-カルボン酸 t e r t -ブチルエステル

白色粉末、収率42%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 37 (3H, t, J=7. 1Hz), 1. 48 (9H, s), 3. 27-3.

15 32 (4H, m), 3. 56-3. 60 (4H, m), 4. 33 (2H, q, J = 7. 1Hz), 6. 84-6. 88 (2H, m), 7. 92-7. 96 (2H, m),

参考例83

4- (4-メチルフェニル) ピペラジン-1-カルボン酸 t e r t-ブチルエス

20 テル

白色粉末、収率55%

 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1. 48(9H, s), 2. 27(3H, s), 3. 04-3. 09(4H, s)

m), 3. 55-3. 59 (4H, m), 6. 82-6. 87 (2H, m), 7.

 $25 \quad 06-7.10 \quad (2H, m)$.

参考例84

4-(4-シアノフェニル)ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル

白色粉末、収率86%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 49 (9H, s), 3. 28-3. 33 (4H, m), 3. 56-3. 60 (4H, m), 6. 83-6. 87 (2H, m), 7. 49-7. 53 (2H, m).

5 参考例85

1-(4-トリフルオロメチルフェニル) ピペラジンの製造

10 え室温で終夜撹拌した。反応液を減圧下濃縮し、残渣を飽和炭酸水素ナトリウム 水溶液で中和して塩化メチレンで抽出した。有機相を硫酸マグネシウムで乾燥後、 濾過した。得られた濾液を減圧濃縮して白色粉末の1-(4-トリフルオロメチ ルフェニル)ピペラジン(2.5g、収率96%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

15 3.01-3.06(4H, m), 3.21-3.26(4H, m), 6.92 (2H, d, J=8.6Hz), 7.48(2H, d, J=8.6Hz)。 対応する出発原料を用い、参考例85と同様にして、参考例86~参考例89の化合物を製造した。

参考例86

20 1- (4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン

白色粉末、収率100%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 61 (1H, s), 3. 00-3. 05 (4H, m), 3. 10-3. 15 (4H, m), 6. 85-6. 92 (2H, m), 7. 08-7. 13 (2H,

25 m)

参考例87

1-(4-ジメチルアミノフェニル)ピペラジン

白色粉末、収率99%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 60 (1H, br), 2. 86 (6H, s), 3. 01 (8H, br), 6. 71-6. 78 (2H, m), 6. 87-6. 92 (2H, m).

参考例88

1-(3-ピリジル)ピペラジン

5 白色粉末、収率100%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

2. 09 (1H, s), 3. 03-3. 09 (4H, m), 3. 14-3. 20 (4H, m), 7. 16-7. 18 (2H, m), 8. 09-8. 11 (1H, m), 8. 31 (1H, s).

10 参考例89

1- (4-エトキシカルボニルフェニル) ピペラジン

白色粉末、収率95%

 $^{1}H-NMR$ (CDCl₃) δ ppm:

1. 37 (3H, t, J=7. 1Hz), 1. 84 (1H, s), 3. 00-3. 15 04 (4H, m), 3. 26-3. 31 (4H, m), 4. 33 (2H, q, J =7. 1Hz), 6. 83-6. 89 (2H, m), 7. 89-7. 96 (2H, m).

参考例90

4- (ピペラジン-1-イル) 安息香酸 tertーブチルエステルの製造
4-ブロモ安息香酸 tertーブチルエステル (4.8g、18.8ミリモル)、ピペラジン (9.7g、0.11モル)、酢酸パラジウム (85mg、0.38ミリモル)、(S)-(-)-BINAP (352mg、0.57ミリモル)及び tertーブトキシナトリウム (2.7g、28.2ミリモル)をトルエン (50ml)中、窒素雰囲気下にて2時間加熱還流した。反応液に酢酸エチン (50ml)中、窒素雰囲気下にて2時間加熱還流した。反応液に酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=5/1)により精製し、灰色粉末の4-(ピペラ

ジン-1-イル) 安息香酸 t e r t - ブチルエステル (3.8g、収率77%)

を得た。

5

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 57 (9H, s), 3. 00-3. 04 (4H, m), 3. 24-3. 29 (4H, m), 6. 83-6. 87 (2H, m), 7. 85-7. 89 (2H, m),

参考例91

ピペラジン-1-カルボン酸4-トリフルオロメトキシベンジルエステルの製造 4-トリフルオロメトキシベンジルアルコール (25g、130.11ミリモ ル) 及びクロロギ酸フェニル (20.37g、130.11ミリモル) を酢酸エ チル (125ml) に溶解し、3℃まで冷却した。ピリジン (11.6ml、1 10 43.12ミリモル)を酢酸エチル (50ml) に溶解した溶液を15℃以下に て35分かけて滴下した。同温度下にて30分撹拌した。反応液を水、3規定塩 酸、10%炭酸カリウム水溶液、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムによ り乾燥した。瀘過後、瀘液を減圧下にて濃縮し、カーボネートを無色オイルとし て得た。ピペラジン(33.62g、390.34ミリモル)をメタノール(1 15 25ml) に溶解し、3℃まで冷却した。そこへ先程のカーボネートを酢酸エチ ル (50m1) に溶解した溶液を10℃以下にて25分かけて滴下した。同温度 下にて1時間撹拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムク ロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=10/1)により精製した。無 色オイルのピペラジンー1ーカルボン酸4ートリフルオロメトキシベンジルエス 20 テル (35.33g、収率89%) を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

2. 57-2. 96 (4H, m), 3. 42-3. 63 (4H, m), 5. 13 (2H, s), 7. 21 (2H, d, J=8. 5Hz), 7. 39 (2H, d,

25 J = 8.5 Hz).

参考例92

ピペラジン-1-カルボン酸3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルエステルの製造

3-(4-トリフルオロメチルフェニル) -2-プロペン-1-オール (1g、

- 4. 95ミリモル)、クロロギ酸フェニル(0. 72ml、5. 69ミリモル)及び酢酸エチル(5ml)の混合物に、氷冷下にてピリジン(0. 5ml、6. 18ミリモル)を酢酸エチル(2ml)に溶解した溶液を徐々に滴下した。室温下にて1時間撹拌した。反応液を水、3規定塩酸、10%炭酸カリウム水溶液、
- 5 飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧下にて濃縮し、カーボネートを無色オイルとして得た。ピペラジン(1.28g、14.84ミリモル)をメタノール(5ml)に溶解し、氷冷下にて先程のカーボネートを酢酸エチル(5ml)に溶解した溶液を徐々に滴下した。室温下にて2.5時間撹拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロ
- 10 マトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=10/1)により精製した。無色 オイルのピペラジン-1-カルボン酸3-(4-トリフルオロメチルフェニル) -2-プロペニルエステル(1.4g、収率90%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

2. 75-2. 95 (4H, m), 3. 43-3. 57 (4H, m), 4. 78

15 (2H, dd, J=1. 2Hz, 6. 0Hz), 6. 33-6. 43 (1H, m), 6. 66 (1H, d, 16. 0Hz), 7. 48 (2H, d, J=8. 4Hz), 7. 57 (2H, d, J=8. 4Hz).

対応する出発原料を用い、参考例92と同様にして、参考例93の化合物を製造した。

20 参考例 9 3

ピペラジン-1-カルボン酸3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-2-プロペニルエステル

無色オイル、収率90%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

25 2. 75-2. 88 (4H, m), 3. 44-3. 52 (4H, m), 4. 75 (2H, dd, J=1. 3Hz, 6. 2Hz), 6. 29 (1H, dt, J=6. 2Hz, 15. 9Hz), 6. 62 (1H, d, J=15. 9Hz), 7. 15 -7. 18 (2H, m), 7. 38-7. 42 (2H, m)。
参考例 9 4

4- (4-クロロフェニル) -1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-カ ルボニルクロリドの製造

4-(4-クロロフェニル)-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン塩酸塩(1g、4.3ミリモル)、ピリジン(680mg、8.6ミリモル)、トリホ スゲン(430mg、1.45ミリモル)及びトルエン(20m1)の混合物を 3時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、ジエチルエーテルにより希釈した。 10%塩酸、水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した。 濾過後、濾液を減圧下にて濃縮し、黄色オイルの4-(4-クロロフェニル)-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-カルボニルクロリド(1g、収率 1090%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

2. 51-2. 72 (2H, m), 3. 81-4. 00 (2H, m), 4. 26
-4. 40 (2H, m), 5. 93-6. 09 (1H, m), 7. 16-7. 3
5 (4H, m).

15 参考例95

1ーベンジルー4ー(4ートリフルオロメチルフェニル)ピペリジンー4ーオールの製造

- 20 (3.1ml、4.67ミリモル)を滴下した。同温度下にて1ーベンジルー4ーピペリドンをTHF(15ml)に溶解した溶液を滴下し、2時間撹拌後、室温下にて2時間撹拌した。酢酸エチルにより希釈し、水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(nーヘキサン/アセトン=2/1)に
- 25 より精製し、白色粉末結晶の1-ベンジルー4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペリジン-4-オール(692mg、収率46%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 60-1. 78 (2H, m), 2. 07-2. 25 (2H, m), 2. 38 -2. 54 (2H, m), 2. 74-2. 87 (2H, m), 3. 59 (2H,

s), 7. 20-7. 38 (5H, m), 7. 51-7. 67 (4H, m)。 参考例 9 6

1-ベンジル-4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジンの製造

- 5 参考例95で製造した1-ベンジル-4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペリジン-4-オール(692mg、2.06ミリモル)、濃塩酸(4.5ml)、及び酢酸(10ml)の混合物を終夜、加熱還流した。反応液を室温に戻し、塩化メチレンにより希釈した。水、10%苛性ソーダ、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧下にて濃縮した。
- 10 残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/アセトン=4/1)により精製し、微黄色粉末結晶の1-ベンジル-4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン(528mg、収率80%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

15 2. 50-2. 60 (2H, m), 2. 62-2. 76 (2H, m), 3. 11
-3. 22 (2H, m), 3. 65 (2H, s), 6. 10-6. 20 (1H, m), 7. 20-7. 54 (9H, m).

参考例97

4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1,2,3,6-テトラヒドロピリ 20 ジン塩酸塩の製造

参考例96で製造した1ーベンジルー4ー(4ートリフルオロメチルフェニル)-1,2,3,6ーテトラヒドロピリジン(2g、6.3ミリモル)を塩化メチレン(20ml)に溶解し、窒素雰囲気下、氷冷下にて2ークロロエチルクロロホルメート(1.67g、11.68ミリモル)を滴下し、同温度下にて3時間撹拌した。メタノール(20ml)を加え、1時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、ジエチルエーテルを加え、析出する結晶を濾取することにより白色粉末結晶の4ー(4ートリフルオロメチルフェニル)-1,2,3,6ーテトラヒドロピリジン塩酸塩(1.44g、収率87%)を得た。

 $^{1}H-NMR$ (DMSO-d₆) δ ppm:

2. 64-2. 80 (2H, m), 3. 18-3. 34 (2H, m), 3. 68
-3. 80 (2H, m), 6. 25-6. 39 (1H, m), 7. 61-7. 8
0 (4H, m).

参考例98

5 4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-カルボニルクロリドの製造

参考例 9 7 で製造した 4 ー (4 ー トリフルオロメチルフェニル) - 1, 2, 3, 6 ーテトラヒドロピリジン塩酸塩 (3 0 0 mg、1. 1 4 ミリモル)、ピリジン (0. 18 m l、2. 2 8 ミリモル)及びトリホスゲン (1 1 2 mg、0. 3 8

10 ミリモル)を用い、参考例 94 と同様にして、黄色オイルの4-(4-1) フルオロメチルフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン<math>-1-カルボニルクロリド(220 m g、収率 67%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

2. 57-2. 75 (2H, m), 3. 82-4. 00 (2H, m), 4. 25

15 -4.40 (2H, m), 6.05-6.16 (1H, m), 7.47 (2H, d, J=8.2Hz), 7.59 (2H, d, J=8.2Hz).

参考例99

4-(4-クロロフェニル)ピペリジン塩酸塩の製造

4-(4-クロロフェニル)-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン塩酸塩 20 (2g、8.7ミリモル)をエタノール(100ml)に溶解し、酸化白金(100mg)を触媒に用いて室温下にて常圧接触還元を行った。反応液をセライト 濾過し、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をジエチルエーテル処理することによって得られる結晶を濾取し、淡灰粉末の4-(4-クロロフェニル)ピペリジン 塩酸塩(1.9g、収率94%)を得た。

 1 H-NMR (DMSO- 1 d $_{6}$) δ ppm:

1. 75-1. 95 (4H, m), 2. 74-3. 05 (3H, m), 3. 25 -3. 44 (2H, m), 7. 25 (2H, d, J=8. 5Hz), 7. 38 (2H, d, J=8. 5Hz).

参考例100

4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペリジンの製造

参考例96で製造した1ーベンジルー4ー(4ートリフルオロメチルフェニル)-1,2,3,6ーテトラヒドロピリジン(528mg、1.66ミリモル)を酢酸(5ml)に溶解し、10%パラジウム/炭素(50mg)を触媒に5 用いて室温下にて常圧接触還元を行った。反応液をセライト濾過し、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣を塩化メチレンに溶解し、水、10%苛性ソーダ、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧下にて濃縮し、黄色オイルの4ー(4ートリフルオロメチルフェニル)ピペリジン(400mg、定量的)を得た。

 $10^{-1}H-NMR$ (CDCl₃) δ ppm:

1. 72-2. 00 (4H, m), 2. 61-2. 84 (3H, m), 3. 07 -3. 27 (2H, m), 7. 32 (2H, d, J=8. 2Hz), 7. 56 (2H, d, J=8. 2Hz).

参考例101

15 4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペリジン-1-カルボニルクロリドの製造

参考例100で製造した4-(4-トリフルオロメチルフェニル) ピペリジン (760mg、3.32ミリモル) を用い、参考例94と同様にして、淡茶オイルの4-(4-トリフルオロメチルフェニル) ピペリジン-1-カルボニルクロ

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

リド(粗製体)を得た。

1. 65-1. 84 (2H, m), 1. 86-2. 02 (2H, m), 2. 77-3. 28 (3H, m), 4. 42-4. 60 (2H, m), 7. 32 (2H, d, J=8. 1Hz), 7. 59 (2H, d, J=8. 1Hz) \circ

25 参考例102

20

2- [3-(4-トリフルオロメチルフェニル) -2-プロペニル] フタルイミ ドの製造

4- (トリフルオロメチル) シンナミルアルコール (3g、14.84ミリモル) をTHF (60ml) に溶解し、フタルイミド (2.84g、19.29ミ

リモル)及びトリフェニルホスフィン(5.84g、22.26ミリモル)を加え、アゾジカルボン酸ジエチル(3.87g、22.26ミリモル)をTHF(20ml)に溶解した溶液を徐々に滴下した。この混合物を室温下にて3時間撹拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(nーヘキサン/塩化メチレン=1/1)により精製し、白色粉末の2ー[3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニル]フタルイミド(4.57g、収率93%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

4. 47 (2H, dd, J=1. 2Hz, 6. 3Hz), 6. 27-6. 41

10 (1H, m), 6. 68 (1H, d, J=15. 9Hz), 7. 44 (2H, d, J=8. 4Hz), 7. 54 (2H, d, J=8. 4Hz), 7. 74 (2H, dd, J=2. 0Hz, 7. 0Hz), 7. 85 (2H, dd, J=2. 0Hz, 7. 0Hz).

参考例103

- 15 3-(4-トリフルオロメチルフェニル) -2-プロペニルアミンの製造 参考例102で製造した2-[3-(4-トリフルオロメチルフェニル) -2 ープロペニル] フタルイミド(4.57g、13.79ミリモル)、ヒドラジン 水和物(897mg、17.93ミリモル)及びエタノール(80ml)の混合 物を3時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、濾過し、濾液を減圧下にて濃縮
- 20 した。残渣に酢酸エチルを加え、1規定苛性ソーダ、飽和食塩水の順に洗浄し、 硫酸マグネシウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧下にて濃縮し、淡茶粉末 結晶の3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルアミン(2. 78g、定量的)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

25 3. 51 (2H, d, J=4. 7Hz), 6. 31-6. 47 (1H, m), 6. 55 (1H, d, J=16. 0Hz), 7. 45 (2H, d, J=8. 3Hz), 7. 55 (2H, d, J=8. 3Hz).

参考例104

ピペラジンー1-イルー (5-クロロベンゾフラン-2-イルメチレン) アミン

の製造

1ーアミノピペラジン(29g、287ミリモル)をイソプロピルアルコール (173m1)に溶解し、5ークロロベンゾフランー2ーアルデヒド (34.52g、191ミリモル)を加え、室温下にて16時間撹拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=10/1)により精製し、黄色粉末結晶のピペラジンー1ーイルー(5ークロロベンゾフランー2ーイルメチレン)アミン(49.49g、収率98%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

10 2. 95-3. 10 (4H, m), 3. 17-3. 29 (4H, m), 6. 70 (1H, s), 7. 20 (1H, dd, J=2. 1Hz, 8. 7Hz), 7. 3 8-7. 52 (3H, m).

参考例105

ピペラジン-1-イルー(4-トリフルオロメチルベンジリデン)アミンの製造 ピペラジン-1-イルーカルバミン酸 t e r t - ブチルエステル(403 m g、2.0ミリモル)を塩化メチレン(4 m 1)に懸濁し、トリフルオロ酢酸(1.6 m 1)を加え、室温で5分間攪拌した。反応混合液に4-(トリフルオロメチル)ベンズアルデヒド(0.3 m 1、2.2ミリモル)を加え、室温下にて1時間撹拌した。反応液を炭酸水素ナトリウム水溶液に注ぎ、酢酸エチルで抽出し、

20 飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=9/1)により精製し、白色固体のピペラジン-1-イルー(4-トリフルオロメチルベンジリデン)アミン(432mg、収率84%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

25 3. 00-3. 29 (8H, m), 7. 43-7. 62 (3H, m), 7. 68 (2H, d, J=8. 2Hz).

参考例106

ピペラジン-1-イル-(4-トリフルオロメトキシベンジリデン) アミンの製造

4-ベンジルピペラジン-1-イルアミン(43.18g、225ミリモル)にエタノール(400ml)を加え、水酸化パラジウム/炭素(6.50g)のエタノール(30ml)懸濁液を加え、水素雰囲気下、室温で3時間、50℃で2時間攪拌した。反応混合液をセライト濾過し、濾液に4-(トリフルオロメトキシ)ベンズアルデヒド(42.92g、225ミリモル)を加え、室温下にて1.5時間撹拌した。反応混合液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=10/1)により精製し、微黄色粉末結晶のピペラジン-1-イルー(4-トリフルオロメトキシベンジリデン)アミン(56.88g、収率93%)を得た。

10 ¹H-NMR (CDCl₃) δppm:
 3.00-3.23 (8H, m), 7.18 (2H, d, J=8.7Hz), 7.58 (1H, s), 7.62 (2H, d, J=8.7Hz)。
 対応する出発原料を用い、参考例106と同様にして、参考例107の化合物を製造した。

15 参考例107

 \mathbb{C}^{n} ピペラジンー1- イルー(5- トリフルオロメチルベンゾフランー2- イルメチレン)アミン

微黄色粉末結晶、収率77%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

20 3.00-3.14(4H, m), 3.23-3.32(4H, m), 6.79 (1H, s), 7.41-7.59(3H, m), 7.82(1H, s)。 参考例108

(4-ベンジルピペラジン-1-イル) - (4-トリフルオロメチルフェニル) アミンの製造

25 4ーブロモベンゾトリフルオリド(3.00g、13.3ミリモル)、4ーベンジルピペラジン-1ーイルアミン(3.06g、16.0ミリモル)、酢酸パラジウム(60mg、0.267ミリモル)、(S)ー(ー)ーBINAP(174mg、0.280ミリモル)、tertーブトキシナトリウム(1.92g、20.0ミリモル)を窒素雰囲気下トルエン(60ml)中にて7時間加熱還流

した。水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧乾燥後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(nーヘキサン/アセトン=4/1)により精製し、微黄色液体の(4ーベンジルピペラジン-1ーイル)-(4ートリフルオロメチル

5 フェニル) アミン (2.666g、収率59%) を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

2. 58 (4H, br), 2. 76 (4H, br), 3. 55 (2H, s), 4. 65 (1H, br), 6. 90 (2H, d, J=8. 6Hz), 7. 23-7. 35 (5H, m), 7. 41 (2H, d, J=8. 6Hz).

10 参考例109

ピペラジン-1-イルー (4ートリフルオロメチルフェニル) アミンの製造 参考例108で製造した (4ーベンジルピペラジン-1-イル) - (4ートリ フルオロメチルフェニル) アミンをエタノール (50ml) に溶解した。10% パラジウム/炭素 (0.53g) を加え、水素雰囲気下、室温で6時間撹拌した。

- 15 さらに60℃で10時間撹拌した。反応液をセライト濾過後、濾液に10%パラジウム/炭素(0.53g)を加え、水素雰囲気下、60℃で8時間撹拌した。 10%パラジウム/炭素をセライトで濾去後、濾液を減圧下濃縮した。得られた 固体を減圧乾燥し、無色固体のピペラジン-1-イルー(4-トリフルオロメチルフェニル)アミン(1.76g、収率90%)を得た。

参考例110

25 4-(3-7) (3-7)

 5

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 46 (9H, s), 1. 48-1. 59 (2H, m), 1. 81-1. 93
10 (2H, m), 3. 01-3. 15 (2H, m), 3. 50-3. 61 (1H, m), 3. 74-3. 87 (2H, m), 4. 19 (2H, d, J=5. 9H z), 6. 29 (1H, ddd, J=5. 9Hz, 5. 9Hz, 15. 9Hz), 6. 61 (1H, d, J=15. 9Hz), 7. 18-7. 43 (5H, m)。
参考例111

4-(3-フェニルー2-プロペニルオキシ)ピペリジンの製造参考例110で製造した4-(3-フェニルー2-プロペニルオキシ)ピペリジン-1-カルボン酸tertーブチルエステル(0.314g、0.989ミリモル)をエタノール(10ml)に溶解し、6規定塩酸(3ml、18ミリモル)を加え60℃で1時間撹拌した。反応液を水酸化ナトリウム水溶液でアルカリ性にした後、塩化メチレンで抽出した。有機相を合わせ、飽和食塩水で洗浄した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮し、減圧下乾燥することにより黄色液体の4-(3-フェニルー2-プロペニルオキシ)ピペリジン(0.198g、収率92%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

25 1. 40-1. 57 (2H, m), 1. 91-2. 02 (2H, m), 2. 56
-2. 70 (2H, m), 3. 12 (2H, ddd, J=4. 2Hz, 4. 2
Hz, 12. 8Hz), 3. 42-3. 52 (1H, m), 4. 19 (2H, d,
J=5. 9Hz), 6. 30 (1H, ddd, J=5. 9Hz, 5. 9Hz, 1
5. 9Hz), 6. 57 (1H, d, J=15. 9Hz), 7. 20-7. 43

(5H, m)

参考例112

4-[3-(4-)クロロフェニル)-2-プロペニルオキシ] ピペリジン-1-カルボン酸 tert

5 4ーヒドロキシピペリジンー1ーカルボン酸tertーブチルエステル(3.58g、17.8ミリモル)をDMF(30ml)に溶解し、水素化ナトリウム(0.71g17.8ミリモル)を加え室温2時間撹拌した。

一方、4-クロロシンナミルアルコール(3.00g、17.8ミリモル)を 塩化メチレン(60ml)に溶解し、トリエチルアミン(5ml、35.6ミリ 10 モル)及びメタンスルホニルクロライド(2.1ml、26.7ミリモル)を氷 冷下滴下し、室温で1.5時間撹拌した。水を加え塩化メチレンで抽出し、有機 相を合わせ、塩酸水溶液、重曹水及び飽和食塩水で洗浄した。有機相を硫酸マグ ネシウムで乾燥後、濾過し、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をDMF10ml に溶解した。

15 この溶液に、先に調整したDMF溶液を氷冷下にて加え、室温まで昇温後、終夜で撹拌した。酢酸エチルで抽出後、有機相を合わせ、水及び飽和食塩水で洗浄した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過し、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(nーヘキサン/酢酸エチル=6/1)により精製し、黄色液体の4-[3-(4-クロロフェニル)-2-プロペコルオキシ]ピペリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(0.759、収率12%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 46 (9H, s), 1. 50-1. 62 (2H, m), 1. 83-1. 94 (2H, m), 3. 03-3. 14 (2H, m), 3. 53-3. 58 (1H,

25 m), 3. 77-3. 83 (2H, m), 4. 17 (1H, d, J=5. 7 Hz), 4. 18 (1H, d, J=5. 7Hz), 6. 27 (1H, ddd, J =5. 7Hz, 5. 7Hz, 15. 9Hz), 6. 57 (1H, d, J=15. 9Hz), 7. 20-7. 33 (4H, m)。

参考例113

4-[3-(4-クロロフェニル) -2-プロペニルオキシ] ピペリジンの製造 参考例112で製造した4-[3-(4-クロロフェニル) -2-プロペニル オキシ] ピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (0.350g、0.995ミリモル) を用い、参考例111と同様にして、茶色液体の4-[3-(4-クロロフェニル) -2-プロペニルオキシ] ピペリジン (0.291g、定量的) を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 38-1. 56 (2H, m), 1. 91-2. 01 (2H, m), 2. 55 -2. 69 (2H, m), 3. 11 (2H, ddd, J=4. 0Hz, 4. 0

10 Hz, 13. 0Hz), 3. 39-3. 51 (1H, m), 4. 18 (2H, d, J=5. 8Hz), 6. 28 (1H, ddd, J=5. 8Hz, 5. 8Hz, 15. 9Hz), 6. 57 (1H, d, J=15. 9Hz), 7. 25-7. 35 (4H, m)

参考例114

参考例112で製造した4-[3-(4-2)ロロフェニル)-2-2ロペニルオキシ]ピペリジン-1-2カルボン酸 1.05ミリモル)をエタノール(10ml)に溶解し、酸化白金(37mg)

- 20 を触媒に用いて室温下にて常圧接触還元を行った。反応液をセライト濾過し、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(nーへキサン/酢酸エチル=4/1)により精製し、黄色液体の4-[3-(4-クロロフェニル)プロポキシ]ピペリジン-1-カルボン酸tertーブチルエステル(0.151g、収率40%)を得た。
- 25 ¹H-NMR (CDCl₃) δ p p m: 1. 40-1. 51 (2H, m), 1. 46 (9H, s), 1. 77-1. 90 (4H, m), 2. 67 (2H, t, J=7. 9Hz), 3. 02-3. 12 (2H, m), 3. 38-3. 45 (3H, m), 3. 73-3. 79 (2H, m), 7. 11 (2H, d, J=8. 4Hz), 7. 24 (2H, d, J=8.

4 H z) 。

参考例115

4-[3-(4-クロロフェニル)プロポキシ]ピペリジンの製造

参考例114で製造した4-[3-(4-クロロフェニル)プロポキシ]ピペ リジン-1-カルボン酸tertーブチルエステルを(0.151g、0.42 7ミリモル)を塩化メチレン(4ml)に溶解し、トリフルオロ酢酸を加え、室温で終夜撹拌した。水酸化ナトリウム水溶液でアルカリ性にした後、塩化メチレンで2回抽出した。有機相を合わせ飽和食塩水で洗浄した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮し、減圧下乾燥することにより茶色液体の4-[3-(4-クロロフェニル)プロポキシ]ピペリジン

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

(0.109g、収率92%)を得た。

1. 35-1. 51 (2H, m), 1. 83-1. 94 (4H, m), 2. 54
-2. 70 (4H, m), 3. 03-3. 14 (2H, m), 3. 22-3. 3

15 8 (1H, m), 3. 43 (2H, t, J=6. 3Hz), 7. 12 (2H, d, J=8. 4Hz), 7. 25 (2H, d, J=8. 4Hz).

参考例116

4-[2-(4-クロロフェニル) エトキシ] ピペリジン-1-カルボン酸 tert

20 (4-クロロベンジル) -トリフェニルーホスホニウムクロリド(1.191g、2.81ミリモル)をDMSO(20ml)に溶解し、氷冷下水素化ナトリウム(0.118g、2.95ミリモル)を加え、室温で1時間撹拌した。そこへ4ーホルミルオキシピペリジンー1ーカルボン酸tertーブチルエステル(0.500g、2.34ミリモル)を加え、室温で終夜撹拌した。酢酸エチルで抽出25 後、有機相を合わせ、水及び飽和食塩水で洗浄した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過し、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/ヘキサン=9/1)により精製し、無色液体を得た。得られた液体を用い、参考例114と同様の方法により、無色液体の4-[2-(4-クロロフェニル)エトキシ]ピペリジン-1-カルボン酸tertーブ

チルエステル(0.127g、収率16%)を得た。

.1 H-NMR (CDCl₃) δppm:

1.40-1.51 (2H, m), 1.45 (9H, s), 1.71-1.79 (2H, m), 2.83 (2H, t, J=6.9Hz), 3.02-3.13

5 (2H, m), 3. 38-3. 44 (1H, m), 3. 62-3. 75 (4H, m), 7. 15 (2H, d, J=8. 5Hz), 7. 25 (2H, d, J=8. 5Hz).

参考例117

4- [2-(4-クロロフェニル) エトキシ] ピペリジンの製造

- 10 参考例116で製造した4-[2-(4-クロロフェニル) エトキシ] ピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (0.127g、0.374ミリモル)を用い、参考例115と同様にして、無色液体の4-[2-(4-クロロフェニル) エトキシ] ピペリジン (0.080g、収率89%)を得た。

 ¹H-NMR (CDC1₃) δ p p m:
- 15 1. 37-1. 48 (2H, m), 1. 84-1. 91 (2H, m), 2. 53
 -2. 63 (2H, m), 2. 83 (2H, t, J=7. 0Hz), 3. 013. 09 (2H, m), 3. 25-3. 41 (1H, m), 3. 64 (2H, t, J=7. 0Hz), 7. 15 (2H, d, J=8. 4Hz), 7. 25 (2H, d, J=8. 4Hz),
- 20 参考例118

1-(2-ニトロビニル)-4-トリフルオロメチルベンゼンの製造 4-トリフルオロメチルベンズアルデヒド(3.00g、17.2ミリモル) をニトロメタン(10ml)に溶解し、酢酸アンモニウム(1.341g、17.4ミリモル)を加え2時間過熱環流した。水を加え塩化メチレンで抽出し、有機

25 相を合わせ飽和食塩水で洗浄した。有機相を硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過し、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-4+4) 作酸エチル= 9/1)により精製し、微黄色固体の1-(2-2+4) ビニル)-4-1 トリフルオロメチルベンゼン(1.596g、収率43%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

7. 58-7. 74 (5H, m), 8. 02 (1H, d, J=13. 8Hz)。 参考例119

2- (4-トリフルオロメチルフェニル) エチルアミンの製造

- 5 水素化リチウムアルミニウム (0.558g、14.7ミリモル)をTHF (10ml) に懸濁した。そこに参考例118で製造した1-(2-ニトロビニル)-4-トリフルオロメチルベンゼン (1.596g、7.35ミリモル)をTHF (10ml) に溶解した溶液を氷冷下滴下し、2時間加熱環流した。メタノールを発泡しなくなるまで徐々に加えた。水 (0.6ml)、15%水酸化ナトリウム水溶液 (0.6ml)、水 (1.8ml) の順に加え、析出物を濾去した。濾液を減圧下濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩基性シリカゲル、塩化メチレン/n-ヘキサン=4/1)により精製し、橙色液体の2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチルアミン (0.431g、収率31%)を得た。
- 15 ¹H-NMR (CDCl₃) δppm:
 2. 81 (2H, t, J=6. 9Hz), 3. 03 (2H, t, J=6. 9 Hz), 7. 32 (2H, d, J=8. 0Hz), 7. 56 (2H, d, J=8. 0Hz).

参考例120

N- (1-ベンジルピペリジン-4-イル) -N- [2-(4-トリフルオロメ チルフェニル) エチル] カルバミン酸 tert-ブチルエステルの製造 参考例119で製造した2-(4-トリフルオロメチルフェニル) エチルアミン (0.431g、2.28ミリモル) 及び1-ベンジル-4-ピペリドン (0.517g、2.73ミリモル) をメタノール (15m1) に溶解し、シアノトリとドロホウ酸ナトリウム (0.429g、6.83ミリモル) 及び酢酸 (0.52m1、9.11ミリモル) を加え、室温終夜撹拌した。減圧濃縮後、酢酸エチルで抽出した。有機相を合わせ、飽和重曹水、飽和食塩水で洗浄した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過し、濾液を減圧下にて濃縮した。得られた残渣をメタノール (5m1) に溶解し、二炭酸ジtert-ブチル (0.597g、2.

74ミリモル)を加え室温で終夜撹拌した。酢酸エチルで抽出し、有機相を合わせ、飽和食塩水で洗浄した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過し、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(nーヘキサン/酢酸エチル=3/1)により精製し、無色液体のN-(1-ベンジルピペリ

5 ジンー4ーイル) -N-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル) エチル] カルバミン酸tertーブチルエステル(0.437g、収率41%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 55 (9H, s), 1. 59-1. 73 (4H, m), 1. 90-2. 10 (2H, m), 2. 82-2. 96 (4H, m), 3. 24-3. 28 (2H,

10 m), 3. 49 (2H, s), 4. 00 (1H, bs), 7. 26-7. 31 (7H, m), 7. 54 (2H, d, J=8.0Hz).

参考例121

- 15 参考例120で製造したN-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-N- [2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチル]カルバミン酸tert-ブチルエステル(0.437g、0.944ミリモル)をエタノール(20m1)に溶解し、20%水酸化パラジウム/炭素(100mg)を触媒に用いて室温下にて常圧接触還元を行った。反応液をセライト濾過し、濾液を減圧下にて濃縮す

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 49 (9H, s), 1. 51-1. 80 (4H, m), 2. 62-3. 49 25 (9H, m), 7. 28-7. 31 (2H, m), 7. 54 (2H, d, J=8. 0Hz)

参考例122

4-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシ)ピペリジン-1-カルボン酸 tert

10

15

4-ビドロキシピペリジン-1-カルボン酸 t e r t -ブチルエステル(1. 88 g、9. 34 ミリモル)をT H F(20 m l)に溶解した。この溶液に、氷冷下、水素化ナトリウム(411 m g、10. 3 ミリモル)を加え、1 時間撹拌した。この混合物に4-(トリフルオロメチル)ベンジルブロミド(2. 23 g、

5 9.34ミリモル)を加え、室温で2時間撹拌した。反応液に水を加え、塩化メチレンで抽出した。この抽出液を硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過して、得られた濾液を減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクログラフィー(塩化メチレン/メタノール=100/1)により精製し、淡黄色油状物質の4-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシ)ピペリジン-1-カルボン酸tertーブチルエ

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

ステル(2.56g、収率76%)を得た。

1. 46 (9H, s), 1. 51-1. 67 (2H, m), 1. 83-1. 91 (2H, m), 3. 07-3. 18 (2H, m), 3. 52-3. 63 (1H, m), 3. 73-3. 83 (2H, m), 4. 61 (2H, m), 7. 46 (2H, d, J=8. 2Hz), 7. 60 (2H, d, J=8. 2Hz).

対応する出発原料を用い、参考例122と同様にして、参考例123の化合物 を製造した。

参考例123

4-(4-トリフルオロメトキシベンジルオキシ)ピペリジン-1-カルボン酸 20 tert-ブチルエステル

淡黄色油状物、収率74%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 46 (9H, s), 1. 51-1. 65 (2H, m), 1. 82-1. 90 (2H, m), 3. 06-3. 17 (2H, m), 3. 52-3. 62 (1H,

25 m), 3. 73-3. 83 (2H, m), 4. 54 (2H, s), 7. 17-7. 20 (2H, m), 7. 35-7. 38 (2H, m).

参考例124

4- (4-トリフルオロメチルベンジルオキシ) ピペリジンの製造 参考例122で製造した4-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシ) ピペ リジンー1ーカルボン酸 t e r t ーブチルエステル (2.56g、7.12ミリモル)を塩化メチレン (20m1) に溶解した。室温下トリフルオロ酢酸 (10ml)を滴下して加え、5時間撹拌した。反応液を減圧濃縮後、残渣を再び塩化メチレンに溶解した。水酸化ナトリウム水溶液でアルカリ性とし塩化メチレンで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮して、白色粉末の4ー (4ートリフルオロメチルベンジルオキシ) ピペリジン (1.85g、収率99%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 46-1. 60(2H, m), 1. 87(1H, s), 1. 93-2. 01

10 (2H, m), 2. 58-2. 69 (2H, m), 3. 07-3. 16 (2H, m), 3. 43-3. 54 (1H, m), 4. 61 (2H, s), 7. 44-7. 48 (2H, m), 7. 57-7. 61 (2H, m).

対応する出発原料を用い、参考例124と同様にして、参考例125~128 の化合物を製造した。

15 参考例125

4- (4-トリフルオロメトキシベンジルオキシ) ピペリジン 白色粉末、収率74%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 45-1. 60 (2H, m), 1. 92-2. 02 (2H, m), 2. 11 20 (1H, s), 2. 59-2. 70 (2H, m), 3. 07-3. 17 (2H, m), 3. 43-3. 54 (1H, m), 4. 55 (2H, s), 7. 17-7. 20 (2H, m), 7. 35-7. 40 (2H, m).

参考例126

4- (4-クロロベンジルオキシ) ピペリジン

25 白色粉末、収率94%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 39-1. 56 (3H, m), 1. 90-1. 99 (2H, m), 2. 55
-2. 66 (2H, m), 3. 06-3. 11 (2H, m), 3. 39-3. 5
1 (1H, m), 4. 52 (2H, s), 7. 25-7. 33 (4H, m).

参考例127

4-(3,4-ジクロロベンジルオキシ)ピペリジン

白色粉末、収率99%

 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1. 45-1. 60 (2H, m), 1. 91-2. 01 (2H, m), 2. 195 (1H, s), 2. 59-2. 70 (2H, m), 3. 07-3. 16 (2H, m)m), 3.42-3.52 (1H, m), 4.50 (2H, s), 7.17 (1 H, dd, J=1.9Hz, 8. 2Hz), 7. 40 (1H, d, J=8.2Hz), 7. 45 (1H, d, J=1. 9Hz).

501

参考例128 10

4- (4-フェニルベンジルオキシ) ピペリジン

白色粉末、収率16%

 $^{1}H-NMR$ (CDCl₃) δ ppm:

1. 45-1.60 (2H, m), 1. 72 (1H, s), 1. 95-2.02(2H, m), 2. 57-2. 68 (2H, m), 3. 07-3. 16 (2H, m)15 m), 3.45-3.56 (1H, m), 4.60 (2H, s), 7.25-7. 60 (9H, m).

参考例129

(1ーベンジルピペリジンー4ーイル) - (4ートリフルオロメトキシフェニ

ル) アミンの製造 20

1-ブロモー4ートリフルオロメトキシベンゼン(2.0g、8.3ミリモ ル)、4-アミノー1-ベンジルピペリジン(1.73g、9.13ミリモル)、酢酸パラジウム (37mg、0.17ミリモル)、(R) - (+) - BINAP (155mg、0.25ミリモル) 及びtert-ブトキシナトリウム(1.2 g、11.6ミリモル)を窒素雰囲気下トルエン(30m1)中にて5時間加熱 25還流した。反応液に酢酸エチル、水を加え撹拌して沈殿物をセライト濾過により 除去した後、濾液を酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸 マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲ ルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=100/1)により

精製し、黒色油状物質の(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-(4-トリフルオロメトキシフェニル)アミン(<math>3.0g、収率99%)を得た。

 $^{1}H-NMR$ (CDCl₃) δ ppm:

1. 39-1. 55 (2H, m), 1. 98-2. 05 (2H, m), 2. 09
5 -2. 20 (2H, m), 2. 80-2. 89 (2H, m), 3. 21-3. 2
8 (1H, m), 3. 52 (2H, s), 3. 52-3. 59 (1H, m), 6.
48-6. 55 (2H, m), 6. 98-7. 02 (2H, m), 7. 22-7.
33 (5H, m).

参考例130

10 ピペリジンー4ーイルー(4ートリフルオロメトキシフェニル)アミンの製造 (1ーベンジルピペリジンー4ーイル)ー(4ートリフルオロメトキシフェニル)アミン(3.0g、8.3ミリモル)をエタノール(30m1)に溶解し、10%パラジウム/炭素を触媒量加え、水素雰囲気下20時間加熱還流した。反応液をセライト濾過し、得られた濾液を減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=10/1)により精製し、無色固体のピペリジンー4ーイルー(4ートリフルオロメトキシフェニル)アミン(2.02g、収率94%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 24-1. 39 (2H, m), 2. 03-2. 08 (2H, m), 2. 65
20 -2. 77 (2H, m), 3. 08-2. 16 (2H, m), 3. 24-3. 4
1 (1H, m), 3. 59 (1H, br), 6. 50-6. 58 (2H, m),
6. 99-7. 03 (2H, m).

参考例131

p-プロモクロロベンゼン(1.91g、9.99ミリモル)、4-アミノピペリジン-1-カルボン酸 t e r t-プチルエステル(2.0g、9.99ミリモル)、酢酸パラジウム(45 mg、0.2ミリモル)、(R) -(+) -BINAP(187 mg、0.3ミリモル)及び t e r t-プトキシナトリウム(1.

35g、14.0ミリモル)を窒素雰囲気下トルエン(20ml)中にて1時間加熱還流した。反応液に酢酸エチル、水を加え撹拌して沈殿物をセライト濾過により除去した後、濾液を酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=100/1)により精製し、黄色粉末の4-(4-クロロフェニルアミノ)ピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル(2.67g、収率86%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 21-1. 54 (2H, m) 1. 46 (9H, s), 1. 99-2. 05

10 (2H, m), 2.85-2.97 (2H, m), 3.37 (1H, br), 3. 51 (1H, br), 4.01-4.07 (2H, m), 6.48-6.54 (2H, m), 7.07-7.14 (2H, m)

対応する出発原料を用い、参考例131と同様にして、参考例132~参考例133の化合物を製造した。

15 参考例132

4-(4-トリフルオロメチルフェニルアミノ)ピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル

黄色粉末、収率93%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

20 1. 21-1. 58 (2H, m), 1. 47 (9H, s), 2. 00-2. 06 (2H, m), 2. 88-2. 99 (2H, m), 3. 47 (1H, br), 3. 88 (1H, bs), 4. 03-4. 09 (1H, m), 6. 56 (2H, d, J=8. 6Hz), 7. 39 (2H, d, J=8. 6Hz)。
参考例133

25 4-(4-シアノフェニルアミノ) ピペリジン-1-カルボン酸 ter t-ブチルエステル

黄色粉末、収率92%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 26-1. 54 (2H, m), 1. 47 (9H, s), 1. 99-2. 05

(2H, m), 2. 87-2. 99 (2H, m), 3. 41-3. 53 (1H, m)br), 4. 02-4. 14 (3H, m), 6. 52-6. 58 (2H, m), 7. 39-7.45(2H, m).

参考例134

4- (4-クロロフェニルアミノ) ピペリジンの製造

参考例131で製造した4-(4-クロロフェニルアミノ)ピペリジン-1-カルボン酸 t e r t ーブチルエステル (2.67g、8.59ミリモル) を塩化 メチレン(20m1)に溶解した。室温下トリフルオロ酢酸(15m1)を滴下 して加え、5時間撹拌した。反応液を減圧濃縮後、残渣を再び塩化メチレンに溶

解した。水酸化ナトリウム水溶液でアルカリとし、塩化メチレンで抽出した。有 10 機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾 液を減圧濃縮して、微黄色粉末の4- (4-クロロフェニルアミノ) ピペリジン (1.76g、収率97%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 22-1. 38 (2H, m), 2. 02-2. 07 (2H, m), 2. 6515 -2.76 (2H, m), 3.08-3.16 (2H, m), 3.25-3.3 8 (1H, m), 3. 50-3. 54 (1H, m), 6. 48-6. 55 (2H, m), 7.06-7.26 (2H, m) $_{\circ}$

対応する出発原料を用い、参考例134と同様にして、参考例135~136 の化合物を製造した。 20

参考例135

4-(4-トリフルオロメチルフェニルアミノ)ピペリジン

黄色粉末、収率97%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 26-1.42 (2H, m), 2. 04-2.09 (2H, m), 2. 6725 -2.78(2H, m), 3.09-3.17(2H, m), 3.34-3.4 6 (1H, m), 3.86-3.90 (1H, m), 6.59 (2H, d, J =8. 6 Hz), 7. 38 (2H, d, J=8.6 Hz).

参考例136

4- (4-シアノフェニルアミノ) ピペリジン

黄色粉末、収率98%

 $^{1}H-NMR$ (CDCl₃) δ ppm:

1. 27-1. 45 (2H, m), 2. 02-2. 07 (2H, m), 2. 67
5 -2. 78 (2H, m), 3. 09-3. 17 (2H, m), 3. 34-3. 4
6 (1H, m), 4. 09-4. 13 (1H, m), 6. 51-6. 57 (2H, m), 7. 38-7. 44 (2H, m).

参考例137

4- (トルエン-4-スルホニルオキシ)ピペリジン-1-カルボン酸 tert 10 -ブチルエステルの製造

- 15 モル)を加えて氷冷した。この混合物に、pートルエンスルホニルクロリド(2.75g、14.4ミリモル)を加え、室温まで昇温しつつ終夜撹拌した。反応液を水に注ぎ、ジエチルエーテルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=100/
- 20 1) により精製し、淡黄色粉末の4-(トルエン-4-スルホニルオキシ) ピペリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(4.16g、収率89%) を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

- 1. 44 (9H, s), 1. 64-1. 82 (4H, m), 2. 44 (3H,
- 25 s), 3. 19-3. 30 (2H, m), 3. 54-3. 64 (2H, m), 4. 63-4. 72 (1H, m), 7. 31-7. 37 (2H, m), 7. 78-7. 82 (2H, m).

参考例138

4- (4-トリフルオロメトキシフェニルスルファニル) ピペリジン-1-カル

ボン酸 t e r t ーブチルエステルの製造

4- (トリフルオロメトキシ) チオフェノール (2.0g、10.3ミリモル)をTHF (30ml)に溶解して氷冷した。水素化ナトリウム (453mg、11.3ミリモル)を加え30分撹拌した後、参考例137で製造した4-(トルエン-4-スルホニルオキシ)ピペリジン-1-カルボン酸tertーブチルエステル (3.66g、10.3ミリモル)を加えて30分間室温で撹拌し、その後1時間加熱還流した。反応液に水を加え、塩化メチレンで抽出した。有機相を硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過して、得られた濾液を減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクログラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=20/1)により精製した。無色油状物質の4-(4-トリフルオロメトキシフェニルスルファニル)ピペリジン-1-カルボン酸tertーブチルエステル (3.12g、収率80%)を得た。

 $^{1}H-NMR$ (CDCl₃) δ ppm:

1. 45 (9H, s), 1. 46-1. 60 (2H, m), 1. 87-1. 95

(2H, m), 2. 86-2. 98 (2H, m), 3. 14-3. 23 (1H, m), 3. 94-4. 00 (2H, m), 7. 13-7. 17 (2H, m), 7. 40-7. 47 (2H, m).

参考例139

4- (4-トリフルオロメトキシフェニルスルファニル) ピペリジンの製造

20 参考例138で製造した4-(4-トリフルオロメトキシフェニルスルファニル) ピペリジン-1-カルボン酸tertーブチルエステルを用い、参考例134と同様にして、無色油状物質の4-(4-トリフルオロメトキシフェニルスルファニル) ピペリジン(収率92%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

25 1. 43-1. 59 (2H, m), 1. 91-1. 98 (2H, m), 2. 59 -2. 70 (2H, m), 3. 06-3. 20 (3H, m), 7. 12-7. 1 6 (2H, m), 7. 40-7. 46 (2H, m).

参考例140

4- (4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペリジン-1-カルボン酸

tertーブチルエステルの製造

トリフェニルー (4ートリフルオロメトキシベンジル) ホスホニウムブロミド (2.0g、3.87ミリモル) をDMSOに溶解し、水素化ナトリウム (168mg、4.2ミリモル) を加え30分間撹拌した。4ーオキソピペリジンー1ーカルボン酸 tertーブチルエステル (700mg、3.51ミリモル) を加え、60℃で2時間撹拌した。反応液を水に注ぎ、ジエチルエーテルで抽出した。 有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた 濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=100/1)により精製し、白色固体を得た。

- 10 この白色固体をメタノールに溶解し、10%Pd-Cを触媒量加え、水素雰囲気下、室温にて3時間撹拌した。反応液を濾過し、得られた濾液を減圧下にて濃縮することにより無色油状物質の4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)ピペリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(1.28g、収率60%)を得た。
- 15 ¹H-NMR (CDCl₃) δppm: 1. 06-1. 21 (2H, m), 1. 45 (9H, s), 1. 57-1. 70 (3H, m), 2. 52-2. 69 (4H, m), 4. 08 (2H, br), 7. 09-7. 17 (4H, m)。

参考例141

20 4-(4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペリジンの製造 参考例140で製造した4-(4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペリジ ン-1-カルボン酸tert-ブチルエステルを用い、参考例134と同様にして、4-(4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペリジンを製造した。 無色固体、収率99%

25 ¹H-NMR (CDCl₃) δppm: 1.06-1.22(2H, m), 1.50(1H, s), 1.53-1.68 (3H, m), 2.48-2.60(4H, m), 3.02-3.08(2H, m), 7.09-7.17(4H, m)。 参考例142 1-ベンジル-4-(4-トリフルオロメトキシベンジリデン)ピペリジンの製造

トリフェニルー (4-トリフルオロメトキシベンジル) ホスホニウムブロミド (21.6g,41.75ミリモル) をDMSOに溶解し、水素化ナトリウム

- 5 (1.82g、45.52ミリモル)を加え、30分間撹拌した。1ーベンジルー4ーピペリドン(7.18g、37.96ミリモル)を加え、60℃で2時間撹拌した。反応液を氷水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル)
- 10 = 10/1)により精製し、黄色油状物質の1-ベンジルー4-(4-トリフル オロメトキシベンジリデン)ピペリジン(9.75g、収率74%)を得た。

 $^{1}H-NMR$ (CDCl₃) δ ppm:

- 2. 36-2. 55 (8H, m), 3. 53 (2H, s), 6. 23 (1H,
- s), 7. 11-7. 34 (9H, m).
- 15 対応する出発原料を用い、参考例142と同様にして、参考例143の化合物 を製造した。

参考例143

1-ベンジル-4-(4-トリフルオロメチルベンジリデン) ピペリジン 黄色油状物、収率52%

 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

2. 38-2. 57 (8H, m), 3. 53 (2H, s), 6. 28 (1H, m), 7. 24-7. 56 (9H, m)

参考例144

4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)ピペリジンの製造(参考例141の 25 化合物の別途合成法)

1-ベンジル-4-(4-トリフルオロメトキシベンジリデン)ピペリジン (9.7g、27.92ミリモル)をエタノール(100m1)に溶解し、6規 定塩酸(9.3m1)を加え氷冷した。10%パラジウム/炭素(970mg)を加え水素雰囲気下、50Cにて5時間撹拌した。反応液をセライト濾過し、得

られた濾液を減圧下にて濃縮し、残渣に水、10%水酸化ナトリウム水溶液を加え、塩化メチレンで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮して無色固体の4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)ピペリジン(6.77g、収率94%)を得た。

5 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1. 06-1. 22 (2H, m), 1. 50 (1H, s), 1. 53-1. 68 (3H, m), 2. 48-2. 60 (4H, m), 3. 02-3. 08 (2H, m), 7. 09-7. 17 (4H, m).

対応する出発原料を用い、参考例144と同様にして、参考例145及び参考 10 例146の化合物を製造した。

参考例145

4-(4-トリフルオロメチルベンジル)ピペリジン

白色固体、収率94%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

15 1.06-1.29 (2H, m), 1.50-1.69 (4H, m), 2.48
-2.60 (4H, m), 3.02-3.09 (2H, m), 7.23-7.2
9 (2H, m), 7.51-7.54 (2H, m).

参考例146

4-(4-クロルベンジル)ピペリジン

20 白色固体、収率 9 4%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 07-1. 21 (2H, m), 1. 53-1. 82 (4H, m), 2. 47
-2. 59 (4H, m), 3. 02-3. 08 (2H, m), 7. 04-7. 0
8 (2H, m), 7. 22-7. 27 (2H, m).

25 参考例147

1 - ベンジルピペリジン-4-カルボン酸N-メチル-N-メトキシアミドの製造

1-ベンジルピペリジン-4-カルボン酸塩酸塩(21g、82.3ミリモル)をクロロホルムに懸濁し、室温下DMF(1ml)及び塩化チオニル(30

m 1) を加え、2 時間加熱還流した。これを減圧下濃縮し、酸クロリドを調整した。

別の容器にN, Oージメチルヒドロキシルアミン塩酸塩(12g、0.12モル)をアセトン(200ml)ー水(20ml)に溶解し、炭酸カリウム(34.5 12g、246.9ミリモル)を加え、氷冷下撹拌した。そこへ先の酸クロリドのアセトン溶液(120ml)を滴下して加え、室温で2時間撹拌した。反応液を減圧下濃縮し、水を加え塩化メチレンで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮することにより茶色油状物質の1ーベンジルピペリジンー4ーカルボン酸Nーメチル10 ーNーメトキシアミド(16.8g、収率78%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 65-1. 92 (4H, m), 1. 97-2. 07 (2H, m), 2. 62
-2. 68 (1H, m), 2. 91-2. 96 (2H, m), 3. 17 (3H, s), 3. 51 (2H, s), 3. 69 (3H, s), 7. 20-7. 32 (5 H, m),

参考例148

15

1 ーベンジルー4ー(4ートリフルオロメトキシベンゾイル)ピペリジンの製造
1 ーブロモー4ートリフルオロメトキシベンゼン(5.3g、22.0ミリモル)を窒素雰囲気下、乾燥THF(70m1)に溶解し、一60℃に冷却し撹拌
20 した。nーブチルリチウム(1.6M)へキサン溶液(15m1、24.0ミリモル)を滴下して加え、一30℃まで昇温しつつ1時間撹拌した。再び一60℃に冷却し、参考例147で製造した1ーベンジルピペリジンー4ーカルボン酸NーメチルーNーメトキシアミド(4.1g、15.6ミリモル)のTHF(10m1)溶液を滴下して加え、同温で1時間、0℃で3時間撹拌した。反応液を氷・1の和塩化アンモニウム水溶液に注ぎ、ジエチルエーテルで抽出した。有機相を水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(nーへキサン/酢酸エチル=4/1)により精製し、淡黄色油状物質の1ーベンジルー4ー(4ートリフルオロメトキシベンゾイル)ピペリジン(4.8g、収率85

%) を得た。

 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1. 80-1. 89(4H, m), 2. 04-2. 18(2H, m), 2. 94-3. 01(2H, m), 3. 15-3. 24(1H, m), 3. 55(2H, m)

5 s), 7. 19-7. 34 (7H, m), 7. 95-8. 01 (2H, m)。 対応する出発原料を用い、参考例148と同様にして、参考例149の化合物を製造した。

参考例149

1ーベンジルー4ー(4ートリフルオロメチルベンゾイル)ピペリジン

10 淡黄色油状物、収率66%

¹H-NMR (CDCl₃) δ p p m:

1. 78-1. 89 (4H, m), 2. 09-2. 19 (2H, m), 2. 94
-3. 02 (2H, m), 3. 16-3. 29 (1H, m), 3. 55 (2H, m), 7. 26-7. 34 (5H, m), 7. 70-7. 74 (2H, m), 8.

15 0.0-8.04(2H, m)

参考例150

4- (4-トリフルオロメトキシベンゾイル) ピペリジンの製造

参考例148で製造した1-ベンジル-4-(4-トリフルオロメトキシベン ゾイル)ピペリジン(4.8g、13.22ミリモル)を塩化メチレン(60

- 20 ml)に溶解し氷冷した。クロロギ酸1ークロロエチル(2.9ml、26.4 ミリモル)を滴下して加え同温にて30分撹拌した。反応液を減圧下にて濃縮して残渣にメタノール(100ml)を加え、15分加熱還流した。反応液に水を加え30分撹拌して、水酸化ナトリウムでアルカリ性とし、塩化メチレンで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得
- - 1. 57-1. 88 (5H, m), 2. 71-2. 81 (2H, m), 3. 15

-3. 23 (2H, m), 3. 29-3. 42 (1H, m), 7. 27-7. 28 (2H, m), 7. 95-8. 05 (2H, m).

対応する出発原料を用い、参考例150と同様にして、参考例151及び参考例152の化合物を製造した。

5 参考例151

4- (4-トリフルオロメチルベンゾイル) ピペリジン

白色固体、収率68%

¹H-NMR (CDCl₃) δ p p m:

1. 61-1. 76 (3H, m), 1. 82-1. 89 (2H, m), 2. 72

10 -2. 83 (2H, m), 3. 16-3. 24 (2H, m), 3. 32-3. 4

4 (1H, m), 7. 72-7. 76 (2H, m), 8. 01-8. 05 (2H, m),

参考例152

4- (4-クロルベンゾイル) ピペリジン

15 白色固体、収率100%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 60-1. 84 (5H, m), 2. 72-2. 83 (2H, m), 3. 16
-3. 24 (2H, m), 3. 30-3. 40 (1H, m), 7. 41-7. 4
7 (2H, m), 7. 85-7. 91 (2H, m)。

20 参考例153

 $N-\{2-[4-(4-) リフルオロメチルフェニル) ピペラジン<math>-1-$ イル] エチル $\}$ フタルイミドの製造

1-(4-)リフルオロメチルフェニル)ピペラジン(5.2g、22.59ミリモル)、N-(2-)フェエチル)フタルルイミド(5.22g、20.5

25 3ミリモル)及び炭酸カリウム(3.36g、24.28ミリモル)をDMF (30ml)中100℃で2時間撹拌した。反応液を冷却して水を加え、酢酸エ チルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄して硫酸マグネシウムで乾燥後、濾 過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマト グラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=50/1)により分離精製し、得られ た結晶をメタノールにより洗浄後、減圧乾燥することにより、白色粉末のNー {2-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン-1-イル] エチル} フタルイミド(4.85g、収率53%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

5 2. 64-2. 72 (6H, m), 3. 18-3. 23 (4H, m), 3. 86 (2H, t, J=6. 4Hz), 6. 89 (2H, d, J=8. 7Hz), 7. 45 (2H, d, J=8. 7Hz), 7. 70-7. 75 (2H, m), 7. 8 1-7. 86 (2H, m),

参考例154

10 2-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン-1-イル] エチルアミンの製造

参考例 1 5 3 で製造したN-{2-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン-1-イル] エチル} フタルイミド(4g、9.92ミリモル) をエタノール(30ml) に懸濁し、ヒドラジン1水和物(0.53ml、10.

- 15 91ミリモル)を加え、5時間加熱還流した。反応液を冷却して析出物を濾取した。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル= 100/1)により分離精製して、白色結晶の2-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジン<math>-1-1ル]エチルアミン(2.87g、収率100%)を得た。
- ¹H-NMR (CDCl₃) δ p p m:
 1. 33 (2H, bs), 2. 49 (2H, t, J=6. 1Hz), 2. 592. 63 (4H, m), 2. 84 (2H, t, J=6. 1Hz), 3. 26-3.
 31 (4H, m), 6. 92 (2H, d, J=8. 7Hz), 7. 48 (2H, d, J=8. 7Hz).
- 25 参考例 1 5 5

N-{2-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン-1-イル] エチル} ホルムアミドの製造

参考例154で製造した2-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン-1-イル] エチルアミン (906mg、3.32ミリモル) をギ酸エチ

ル (10ml) 中、5時間加熱還流した。反応液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=100/1)により分離精製して、白色粉末の $N-\{2-[4-(4-k)])$ オルンアミド(942mg、収率94%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

2. 53-2. 65 (6H, m), 3. 26-3. 31 (4H, m), 3. 42 -3. 49 (2H, m), 6. 05 (1H, bs), 6. 92 (2H, d, J= 8. 7Hz), 7. 49 (2H, d, J=8. 7Hz), 8. 21 (1H, s).

10 参考例156

N-メチルー $\{2-[4-(4-$ トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン-1 -イル] エチル $\}$ アミンの製造

水素化リチウムアルミニウム(237mg、6.25ミリモル)をTHF(20ml)に懸濁し、氷冷下撹拌した。そこへ参考例155で製造したN-{2-

- 15 [4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジン-1-イル]エチル ホルムアミド(942mg、3.13ミリモル)のTHF(10ml)溶液を滴下して加え、室温で2時間撹拌後、2時間加熱還流した。反応液を冷却して水、15%水酸化ナトリウム水溶液を注意深く加え反応を終了させた。硫酸ナトリウムを加え激しく撹拌して、セライト濾過した。濾液を減圧濃縮して、黄色油状物質
- 20 のN-メチルー $\{2-[4-(4-h)]$ フルオロメチルフェニル) ピペラジンー 1-4ル] エチル $\}$ アミン(900mg、収率100%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

2. 47 (3H, s), 2. 52-2.74 (8H, m), 3. 26-3.30 (4H, m), 3. 71-3.77 (1H, m), 6. 91 (2H, d, J=8.

25 7 Hz), 7. 47 (2H, d, J=8. 7 Hz).

参考例157

4- (2-メチルアミノエチル) ピペラジン-1-カルボン酸 tertーブチルエステルの製造

4- (2-クロロエチル) ピペラジン-1-カルボン酸 tertーブチルエス

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 46 (9H, m), 1. 66 (1H, s), 2. 36-2. 41 (4H, m), 2. 45 (3H, s), 2. 46-2. 53 (2H, m), 2. 65-2.

10 70 (2H, m), 3.40-3.44 (4H, m)。 参考例158

N-[2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) エチル] フタルイミドの製造 N-(2-ヒドロキシエチル) フタルイミド(3.59g、18.75ミリモル)、4-ヒドロキシベンゾトリフルオリド(3.04g、18.75ミリモ

15 ル)、アゾジカルボン酸ジエチル(4.37ml、28.13ミリモル)及びトリフェニルホスフィン(7.38g、28.13ミリモル)をTHF(50ml)に溶解して室温にて終夜撹拌した。反応液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクログラフィー(nーヘキサン/酢酸エチル=5/1)により精製した。白色結晶のN-[2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)エチル]フタルイ

20 ミド(4.05g、収率69%)を得た。

 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

4. 11-4. 16 (2H, m), 4. 25-4. 30 (2H, m), 6. 92
-6. 96 (2H, m), 7. 48-7. 52 (2H, m), 7. 72-7. 7
7 (2H, m), 7. 83-7. 89 (2H, m).

25 参考例 1 5 9

2- (4-トリフルオロメチルフェノキシ) エチルアミンの製造

参考例158で製造したN-[2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)エチル]フタルイミドを用い、参考例154と同様にして、2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)エチルアミンを得た。

無色油状物、収率95%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 36 (2H, s), 3. 11 (2H, t, J=5.1Hz), 4. 03 (2H, t, J=5.1Hz), 6. 97 (2H, d, J=8.6Hz), 7. 54 (2H, d, J=8.6Hz)

参考例160

5

N-[2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) エチル] ホルムアミドの製造 参考例159で製造した2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) エチルアミン(1.38g、6.72ミリモル) をギ酸エチル(10ml) 中、5時間加10 熱還流した。反応液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=100/1) により分離精製して、白色粉末のN-[2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) エチル] ホルムアミド(1.51g、収率97%) を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

15 3. 72-3. 78 (2H, m), 4. 09-4. 13 (2H, m), 6. 02 (1H, bs), 6. 96 (2H, d, J=8. 6Hz), 7. 56 (2H, d, J=8. 6Hz), 8. 24 (1H, s).

参考例161

N-メチル-N- [2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) エチル] アミン 20 の製造

参考例160で製造したN-[2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) エチル] ホルムアミド(2.02g、8.66ミリモル)をTHF(20m1)に溶解した。氷冷下ボラン-THF錯体1M溶液(21.7m1、21.7ミリモル)を滴下して加え、終夜撹拌した。反応液を冷却して水、6N塩酸を加え20分撹拌した。水酸化ナトリウム水溶液でアルカリ性として塩化メチレンで抽出した。有機相を硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=200/1)により分離精製することにより、白色粉末のN-メチル-N-[2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)エチル]アミン(1.05g、

収率55%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

2. 68 (3H, d, J = 5.8Hz), 3. 05-3. 28 (2H, m), 4. 06 (1H, br), 4. 10-4. 18 (1H, m), 4. 45-4. 54

5 (1H, m), 6. 98 (2H, d, J=8.5Hz), 7. 58 (2H, d, J=8.5Hz).

参考例162

NーメチルーNー [2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) エチル] アミンの製造

10 1-(2-ブロモエトキシ)-4-トリフルオロメトキシベンゼン(2.2g、7.72ミリモル)をメタノール(20ml)に溶解し、40%メチルアミンメタノール溶液(20ml)を加え、5時間加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、塩化メチレンで希釈して飽和炭酸水素ナトリウムで洗浄した。有機相を硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過し、得られた濾液を減圧下にて濃縮して、微黄色油状物

15 質のN-メチル-N-[2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) エチル] アミン (1.44g、収率79%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δ p p m:

1. 54 (1H, s), 2. 51 (3H, s), 2. 97 (2H, t, J=5. 1Hz), 4. 06 (2H, t, J=5. 1Hz), 6. 85-6. 92 (2H,

20 m), 7. 10-7. 17 (2H, m).

参考例163

N-メチル-N- [2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) エチル] アミンの製造

1-(2-ブロモエトキシ)-4-(トリフルオロメチル)ベンゼンを用い、

25 参考例 1 6 2 と同様にして、N-メチル-N-[2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) エチル] アミンを製造した。

白色粉末、収率82%。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

2. 68 (3H, d, J = 5. 8Hz), 3. 02-3. 28 (2H, m), 3.

92-4. 18 (2H, m), 4. 41-4. 54 (1H, m), 6. 98 (2H, d, J=8. 5Hz), 7. 58 (2H, d, J=8. 5Hz)。 参考例164

N, N' -ジメチル-N- (4-トリフルオロメチルフェニル)-1, 2-エチ 5 レンジアミンの製造

4-ブロモベンゾトリフルオリド (3.0g、13.3ミリモル)、N, N' -ジメチルエチレンジアミン (9.4g、0.11モル)、酢酸パラジウム (6 0mg、0.27ミリモル)、BINAP (250mg、0.40ミリモル)及 びtert-ブトキシナトリウム (1.80g、18.7ミリモル)を窒素雰囲 10 気下トルエン (20m1) 中にて3時間加熱還流した。反応液に酢酸エチル、水

- 10 気下トルエン(20m1)中にて3時間加熱還流した。反応液に酢酸エチル、水を加え、撹拌して沈殿物をセライト濾過により除去した後、濾液を酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=10/1)により精製し、淡黄色油状物質のN,N'-
- 15 ジメチル-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1, 2-エチレンジアミン $(650 \, \mathrm{mg} \, \mathrm{v} \, \mathrm{we} \, 21\%)$ を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 53 (1H, s), 2. 47 (3H, s), 2. 82 (2H, t, J=6. 7Hz), 3. 02 (3H, s), 3. 52 (2H, t, J=6. 7Hz), 6.

20 74 (2H, d, J=8.8Hz), 7.43 (2H, d, J=8.8Hz)。 参考例165

N-[1-(4-クロロフェニル) ピペリジン-4-イル] -N-メチルカルバミン酸 t e r t - ブチルエステルの製造

pーブロモクロロベンゼン (3.13g、16.3ミリモル)、(ピペリジン25 -4-イル) -N-メチルカルバミン酸 tertーブチルエステル (3.5g、10.8ミリモル)、酢酸パラジウム (73mg、0.33ミリモル)、(S)-(-)-BINAP (305mg、0.49ミリモル)及びtertーブトキシナトリウム (2.2g、22.9ミリモル)を窒素雰囲気下トルエン (30ml)中にて3時間加熱還流した。反応液に酢酸エチル、水を加え、撹拌して沈

殿物をセライト濾過により除去した後、濾液を酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=10/1)により精製し、黄色粉末のN-[1-(4-クロロフェニル)ピペリジン-4-イル]-N-メチルカルバミン酸tert-ブチルエステル

5 ピペリジンー4ーイル] -Nーメチルカルバミン酸tertーブチルエステル (4.7g、収率89%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 47 (9H, s), 1. 70-1. 90 (4H, m), 2. 73-2. 82 (2H, m), 2. 74 (3H, s), 3. 64-3. 71 (2H, m), 4.

10 08 (1H, br), 6.81-6.87 (2H, m), 7.15-7.22 (2H, m),

対応する出発原料を用い、参考例165と同様にして、参考例166~参考例168の化合物を製造した。

参考例166

収率88%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 48 (9H, s), 1. 72-1. 91 (4H, m), 2. 76 (3H,

20 s), 2. 79-2. 85 (2H, m), 3. 67-3. 73 (2H, m), 4. 10 (1H, br), 6. 86-6. 93 (2H, m), 7. 07-7. 11 (2H, m).

参考例167

N-[1-(4-トリフルオロメチルフェニル) ピペリジン<math>-4-イル] -N-メチルカルバミン酸 ter t-ブチルエステルの製造

収率91%

25

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

- 1. 47 (9H, s), 1. 72-1. 87 (4H, m), 2. 74 (3H,
- s), 2.82-2.94 (2H, m), 3.83-3.89 (2H, m), 4.

12 (1H, br), 6. 92 (2H, d, J=8.7Hz), 7. 46 (2H, d, J=8.7Hz).

参考例168

N-[1-(4-シアノフェニル)ピペリジン-4-イル]-N-メチルカルバ

5 ミン酸 t e r t ー ブチルエステルの製造

収率73%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

- 1. 47 (9H, s), 1. 69-1. 77 (4H, m), 2. 73 (3H,
- s), 2. 87-3.00 (2H, m), 3. 89-3.97 (2H, m), 4.
- 10 16 (1H, br), 6.84-6.89 (2H, m), 7.45-7.51 (2H, m).

参考例169

N-[1-(4-クロロフェニル) ピペリジン<math>-4-イル] -N-メチルアミンの製造

- 15 参考例165で製造したN-[1-(4-クロロフェニル)ピペリジン-4-イル]-N-メチルカルバミン酸tertーブチルエステル(4.71g、14.5ミリモル)を塩化メチレン(30ml)に溶解した。室温下トリフルオロ酢酸(20ml)を滴下して加え、5時間撹拌した。反応液を減圧濃縮後、残渣を再び塩化メチレンに溶解し、水酸化ナトリウム水溶液でアルカリ性とし、塩化メチ
- 20 レンで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮して、薄茶色粉末のN-[1-(4-クロロフェニル)ピペリジン-4-イル]-N-メチルアミン(3.1g、収率95%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

25 0. 99 (1H, s), 1. 38-1. 54 (2H, m), 1. 95-2. 00 (2H, m), 2. 44-2. 54 (1H, m), 2. 46 (3H, s), 2. 71-2. 82 (2H, m), 3. 55-3. 63 (2H, m), 6. 81-6. 87 (2H, m), 7. 14-7. 21 (2H, m).

対応する出発原料を用い、参考例169と同様にして、参考例170~参考例

172の化合物を製造した。

参考例170

N- [1-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペリジン-4-イル] -N ーメチルアミン

5 薄茶色粉末、収率100%

¹H-NMR (CDCl₂) δppm:

0. 96 (1H, s), 1. 39-1. 55 (2H, m), 1. 96-2. 02 (2H, m), 2. 44-2. 57 (1H, m), 2. 47 (3H, s), 2. 73-2.84 (2H, m), 3.58-3.66 (2H, m), 6.86-6.

92 (2H, m), 7.05-7.10 (2H, m). 10

参考例171

N-[1-(4-トリフルオロメチルフェニル) ピペリジン-4-イル] -N-メチルアミン

薄茶色粉末、収率100%

- ¹H-NMR (CDCl₃) δppm: 15
 - 0. 96 (1H, s), 1. 36-1. 52 (2H, m), 1. 96-2. 02(2H, m), 2. 47 (3H, s), 2. 50-2. 62 (1H, m), 2. 82-2.94 (2H, m), 3.72-3.80 (2H, m), 6.92 (2 H, d, J = 8.8 Hz), 7.45 (2H, d, J = 8.8 Hz).
- 参考例172 20

N- [1-(4-シアノフェニル) ピペリジン-4-イル] -N-メチルアミン 薄茶色粉末、収率99%

 $^{1}H-NMR$ (CDCl₃) δ ppm:

1. 05 (1H, s), 1. 34-1. 49 (2H, m), 1. 95-2. 02

(2H, m), 2.47 (3H, s), 2.55-2.67 (1H, m), 2. 25 90-3.01 (2H, m), 3.76-3.84 (2H, m), 6.82-6.

90 (2H, m), 7. 43-7. 50 (2H, m).

参考例173

N-(2-メチル-2-プロペニル)カルバミン酸ベンジルエステルの製造

2ーメタリルアミン塩酸塩(21.52g、0.2モル)を水(200ml)に溶解し、クロロギ酸ベンジル(37.53g、0.22モル)を加え氷冷した。炭酸ナトリウム(46.63g、0.44モル)を少しずつ加え、3時間室温で撹拌した。塩化メチレンにより2回抽出後、有機相を合わせ、硫酸ナトリウムで 乾燥後、濾過し、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(nーヘキサン/酢酸エチル=7/1)により精製し、無色液体のNー(2ーメチルー2ープロペニル)カルバミン酸ベンジルエステル(41.58g、定量的)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

10 1.74 (3H, s), 3.75 (2H, d, J=6.2Hz), 4.69-4. 94 (2H, m), 5.13 (2H, s), 7.26-7.39 (5H, m)。 参考例174

N-(2-メチル-2-プロペニル) カルバミン酸4-クロロベンジルエステルの製造

- 15 4-クロロベンジルアルコール (3.00g、21.0ミリモル)及びトリホスゲン (3.12g、10.5ミリモル)をトルエン (15ml)に溶解し、氷冷下N-エチルジイソプロピルエチルアミン (3.6ml、21.0ミリモル)を加え、1時間撹拌した。塩化メチレンと水を加え抽出し、有機相を合わせ硫酸マグネシウムで乾燥した。濾過し、濾液を減圧下にて濃縮した。得られた残渣に
- 20 水 (40m1)、2-メタリルアミン塩酸塩(2.49g、23.1ミリモル)を加え、氷冷下炭酸ナトリウム(5.15g、48.6ミリモル)を加え15分 撹拌した。塩化メチレンを加えて抽出し、有機相を合わせ、硫酸マグネシウムで 乾燥した後、濾過し、濾液を減圧下にて濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカ ラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=10/1)により精製し、
- 25 無色液体のN-(2-メチル-2-プロペニル) カルバミン酸 4-クロロベンジ ルエステル (4.06g、収率80%) を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 74 (3H, s), 3. 74 (2H, d, J = 5.8Hz), 4. 73-4.91 (2H, m), 5. 08 (2H, s), 7. 26-7.41 (4H, m) 参考例175

N-(2-メチル-2-プロペニル) カルバミン酸4-フルオロベンジルエステルの製造

4ーフルオロベンジルアルコール (3.00g、23.8ミリモル)をTHF (60ml)に溶解し、氷冷下1,1'ーカルボニルジイミダゾール (4.05g、25.0ミリモル)を加え30分撹拌した。2ーメタリルアミン塩酸塩 (2.81g、26.2ミリモル)、トリエチルアミン (3.98g、28.5ミリモル)を加え、氷冷下2時間撹拌した。減圧濃縮後、塩化メチレンと水を加えて抽出した。合わせた有機相を硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過した。濾液を減圧下濃0 縮後、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (nーヘキサン/酢酸エチル=10

10 縮後、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=10/1)で精製し、無色液体のN-(2-メチル-2-プロペニル)カルバミン酸 4-フルオロベンジルエステル(4.69g、収率88%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 73 (3H, s), 3. 74 (2H, d, J=5. 8Hz), 4. 55-4.

15 95 (3H, m), 5. 08 (2H, s), 6. 95-7. 14 (2H, m), 7. 27-7. 41 (2H, m)

参考例176

3-メトキシメトキシー2-メチル-1-プロペンの製造

2ーメチルー2ープロペンー1ーオール(50g、693ミリモル)のTHF 20 (500ml) 溶液に氷冷攪拌下、クロロメチルメチルエーテル(105ml、1386ミリモル)とNーエチルジイソプロピルアミン(265ml、1525ミリモル)を加え、室温で2時間攪拌した。反応混合液を濾過し、ジエチルエーテルで洗浄し、濾液を減圧濃縮した。残渣をジエチルエーテルに溶解し、水、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃25 縮して、無色液体の3ーメトキシメトキシー2ーメチルー1ープロペン(9.7g、収率12%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 76 (3H, s), 3. 39 (3H, s), 3. 97 (2H, s), 4. 6 5 (2H, s), 4. 85-4. 94 (1H, m), 4. 98-5. 06 (1H, m)。

参考例177

2-メトキシメトキシメチル-2-メチルオキシランの製造

参考例176で製造した3-メトキシメトキシー2-メチルー1-プロペン

- 5 (9.7g、84ミリモル)の塩化メチレン(200ml)溶液に、mークロロ 過安息香酸(22.7g、92ミリモル)を氷冷攪拌下、少量ずつ加え、室温下 6時間攪拌後、炭酸水素ナトリウム(14.1g、168ミリモル),水及び塩 化メチレンを加え、攪拌した。分液し、炭酸水素ナトリウム水溶液、チオ硫酸ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥
- 10 後、減圧濃縮して、緑色液体の2-メトキシメトキシメチル-2-メチルオキシラン(6.8g、収率62%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 40 (3H, s), 2. 65 (1H, d, J=4. 9Hz), 2. 78 (1H, d, J=4. 9Hz), 3. 38 (3H, s), 3. 53 (1H, d, J=4. 9Hz)

15 11. 1Hz), 3. 62 (1H, d, J=11.1Hz), 4. 65 (2H, s).

参考例178

4-(4-)クロロベンジル)ピペラジンー1-カルボン酸 t e r t - ブチルエステルの製造

- 20 ピペラジン-1-カルボン酸 t e r t ブチルエステル (1.5 g、8.05 ミリモル) のDMF (10 m l) 溶液に、炭酸カリウム (1.45 g、10.4 7ミリモル) 及び4-クロロベンジルクロリド (1.82 g、8.86ミリモル) を加え、50℃で1時間攪拌した。酢酸エチルで希釈し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフ
- 25 ィー(塩化メチレン/酢酸エチル= 9 / 1)により精製し、無色液体の 4-(4-2) (4 ークロロベンジル)ピペラジンー 1-2 (2.50g、定量的)を得た。
 - ¹H-NMR (CDCl₃) δppm:
 - 1. 45 (9H, s), 2. 36 (4H, t, J=5. 0Hz), 3. 42 (4

H, t, J=5.0Hz), 3.46 (2H, s), 7.23-7.31 (4H, m).

参考例179

1- (4-クロロベンジル) ピペラジンの製造

- 5 参考例178で製造した4-(4-クロロベンジル)ピペラジン-1-カルボン酸tertーブチルエステル(2.50g、8.05ミリモル)の塩化メチレン(16ml)溶液にトリフルオロ酢酸(8ml)を加え、室温で5時間攪拌した。反応液を減圧濃縮した。残渣に苛性ソーダ水溶液を加え、塩化メチレンにより抽出し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を濃縮し、無色液
- 40 体の1-(4-クロロベンジル)ピペラジン(1.70g、定量的)を得た。
 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δppm:

 55-2.74(4H, m), 3.57-3.76(6H, m), 7.35-7.45(4H, m), 8.55-8.88(1H, br)。

参考例180

収率100%

- 15 1-(4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジンの製造 4-(4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルを用い、参考例179と同様にして、1-(4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジンを製造した。 収率100%
- 20 ¹H-NMR (CDCl₃) δppm:
 2. 72 (4H, t, J=4. 9Hz), 3. 16-3. 26 (4H, m), 3. 62 (2H, s), 7. 44 (2H, d, J=8. 1Hz), 7. 59 (2H, d, J=8. 1Hz)。
 参考例181
- 25 1-(4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペラジンの製造 4-(4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルを用い、参考例179と同様にして、1-(4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペラジンを製造した。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

2. 70 (4H, t, J=4.9Hz), 3. 19 (4H, t, J=4.9Hz), 3. 56 (2H, s), 7. 17 (2H, d, J=7.9Hz), 7. 33 (2H, d, J=7.9Hz).

5 参考例182

4- [4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)ピペラジン-1-イル]フェ ノールの製造

4-(4-)ドロキシフェニル)ピペラジン(3g、16.8 ミリモル)及び 4-トリフルオロメトキシベンズアルデヒド(3.36g、17.7 ミリモル)

- 10 をメタノール(60ml)及び塩化メチレン(15ml)に溶解した。この溶液に、氷冷下、シアノトリヒドロホウ酸ナトリウム(1.59g、25.3ミリモル)及び酢酸(1.6ml)を加え、室温まで昇温させ2時間撹拌した。飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び塩化メチレンを加え、撹拌し、塩化メチレンで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得
- 15 られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=100/1) により分離精製し、白色粉末結晶の 4- [4-(4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペラジン-1-イル] フェノール (3.36g、収率57%) を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

20 2. 59-2. 64 (4H, m), 3. 05-3. 10 (4H, m), 3. 56 (2H, s), 4. 90-5. 40 (1H, br), 6. 69-6. 75 (2H, m), 6. 79-6. 85 (2H, m), 7. 16 (2H, d, J=8. 4Hz), 7. 37 (2H, d, J=8. 4Hz).

参考例183

25 1- [4-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ) フェニル] -4-(4-ト リフルオロメトキシフェニル) ピペラジンの製造

1-(4-h)フルオロメトキシフェニル)ピペラジン(4.4g、17.8ミリモル)、2-(4-)ブロモフェノキシ)テトラヒドロピラン(4.6g、17.8ミリモル)、酢酸パラジウム(159mg、0.71ミリモル)、BIN

AP (666mg、1.07ミリモル)及びtertーブトキシナトリウム(2.2g、23.1ミリモル)を窒素雰囲気下、トルエン(40ml)中にて5時間加熱還流した。反応液に酢酸エチル及び水を加え、撹拌して沈殿物をセライト濾過により除去した後、濾液を酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(nーヘキサン/酢酸エチル=20/1)により精製し、白色粉末の1-[4-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)フェニル]-4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペラジン(2.7g、収率35%)を得た。

15 本化合物は、参考例185の方法でも製造した。 参考例184

1- [4-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ) フェニル] ピペラジンの製造

2- (4-ブロモフェノキシ) テトラヒドロピラン (7.8g、30.3ミリ モル)、ピペラジン (15.7g、180ミリモル)、酢酸パラジウム (136 mg、0.61ミリモル)、BINAP (567mg、0.91ミリモル)及び tertーブトキシナトリウム (3.8g、39.4ミリモル)を窒素雰囲気下トルエン (50m1) 中にて2時間加熱還流した。反応液に酢酸エチル及び水を 加え、撹拌して沈殿物をセライト濾過により除去した後、濾液を酢酸エチルで抽 出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。 得られた濾液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (nーヘキサン/酢酸エチル=20/1)により精製し、淡灰色粉末の1-[4-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)フェニル]ピペラジン (6.8g、収率85%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 57-2. 04 (6H, m), 3. 00-3. 06 (8H, m), 3. 53
-3. 66 (1H, m), 3. 89-3. 99 (1H, m), 5. 29-5. 3
2 (1H, m), 6. 84-6. 90 (2H, m), 6. 95-7. 02 (2H, m),

参考例185

5

1- [4-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)フェニル]-4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペラジンの製造(参考例183の化合物の別途合成法)

10 参考例184で製造した1- [4-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)フェニル] ピペラジン(2.1g、8.05ミリモル)、4-トリフルオロメトキシー1-ブロモベンゼン(1.9g、8.05ミリモル)、酢酸パラジウム(72mg、0.32ミリモル)、BINAP(300mg、0.48ミリモル)及びtert-ブトキシナトリウム(1.0g、10.5ミリモル)を窒素雰囲気下トルエン(30ml)中にて5時間加熱還流した。反応液に酢酸エチル及び水を加え、撹拌して沈殿物をセライト濾過により除去した後、濾液を酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=20/1)により精製し、白色粉末の1-[40-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)フェニル]-4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペラジン(3.1g、収率90%)を得た。

参考例186

4- [4-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン-1-イル] フェノールの製造

25 参考例185で製造した1-[4-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)フェニル]-4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペラジン(2.65g、6.27ミリモル)をエタノール(50m1)に懸濁し、ピリジニウムpートルエンスルホナート(473mg、1.88ミリモル)を加え70℃で5時間撹拌した。エタノールを減圧留去して残渣に塩化メチレン、飽和炭酸水素ナトリ

ウム水溶液を加え撹拌した。これを塩化メチレンで抽出し、硫酸マグネシウムで 乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマ トグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=10/1)により精製し、白色粉末 の4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペラジン-1-イル]フ ェノール(1.95g、収率92%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

3. 19-3. 24 (4H, m), 3. 29-3. 34 (4H, m), 4. 50 (1H, s), 6. 76-6. 80 (2H, m), 6. 87-6. 97 (4H, m), 7. 11-7. 15 (2H, m).

10 対応する出発原料を用い、参考例186と同様にして、参考例187及び参考 例188の化合物を製造した。

参考例187

4-[4-(4-)リフルオロメチルフェニル)ピペラジン-1-イル]フェノール

15 白色粉末、収率82%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

3. 18-3. 23 (4H, m), 3. 41-3. 45 (4H, m), 4. 47 (1H, s), 6. 76-6. 82 (2H, m), 6. 87-7. 00 (4H, m), 7. 48-7. 52 (2H, m).

20 参考例188

4- [4-(4-クロロフェニル) ピペラジン-1-イル] フェノール 白色粉末、収率23%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

3. 18-3. 23 (4H, m), 3. 28-3. 32 (4H, m), 4. 45
25 (1H, s), 6. 77-6. 81 (2H, m), 6. 87-6, 92 (4H, m), 7. 21-7. 24 (2H, m).

参考例189

4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)ピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

4-ヒドロキシピペリジン-1-カルボン酸 t e r t ーブチルエステル (56. 5g、0.28モル)、4ートリフルオロメトキシフェノール (50g、0.28モル)及びトリフェニルホスフィン (108g、0.42モル)をTHF (50ml)に溶解した。これを加熱還流下アゾジカルボン酸ジエチル (65ml、0.42モル)を滴下して加え、5時間撹拌した。反応液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクログラフィー (nーヘキサン/酢酸エチル=5/1)により精製し、無色オイルの4ー (4ートリフルオロメトキシフェノキシ)ピペリジンー1ーカルボン酸 t e r t ーブチルエステル (92g、収率91%)を得た。

1H-NMR (CDCl3) δ p pm:

10 1. 47 (9H, s), 1. 69-1. 80 (2H, m), 1. 85-1. 96 (2H, m), 3. 28-3. 39 (2H, m), 3. 64-3. 75 (2H, m), 4. 40-4. 46 (1H, m), 6. 85-6. 92 (2H, m), 7. 11-7. 15 (2H, m).

参考例190

15 4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジンの製造

参考例189で製造した4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)ピペリジン-1-カルボン酸tertーブチルエステル(92g、254.59ミリモル)を塩化メチレン(100ml)に溶解した。室温下トリフルオロ酢酸(200ml)を滴下して加え、終夜撹拌した。反応液を減圧濃縮後、残渣を再び塩化20メチレンに溶解した。水酸化ナトリウム水溶液でアルカリ性とし、塩化メチレンで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=5/1)により精製し、白色粉末の4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)ピペリジン(55g、収率83%)を得た。

 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1. 65-1. 78 (2H, m), 2. 00-2. 07 (2H, m), 2. 73. -2. 83 (2H, m), 3. 12-3. 21 (2H, m), 4. 32-4. 3 8 (2H, m), 6. 85-6. 92 (2H, m), 7. 10-7. 15 (2H, m),

参考例191

1-[4-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)フェニル]-4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)ピペリジンの製造

参考例190で製造した4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリ ジン(30.3g、0.116モル)、2-(4-ブロモフェノキシ) テトラヒドロピラン(30g、0.116モル)、酢酸パラジウム(1.0g、4.64ミリモル)、BINAP(4.3g、6.96ミリモル)及び炭酸セシウム(49g、0.151モル)を窒素雰囲気下トルエン(300m1)中にて30時間加熱還流した。反応液に酢酸エチル及び水を加え、撹拌して沈殿物をセライト濾 過により除去した後、濾液を酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=20/1)により精製し、黄色粉末の1-[4-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)フェニル]-4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)ピペリジン(32.

15 6 g、収率 6 4%) を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 55-1. 75 (3H, m), 1. 81-2. 20 (7H, m), 2. 95
-3. 04 (2H, m), 3. 38-3. 42 (2H, m), 3. 55-3. 6
6 (1H, m), 3. 87-3. 99 (1H, m), 4.36-4. 45 (1H,

20 m), 5. 29-5. 32 (1H, m), 6. 89-7. 01 (6H, m), 7. 11-7. 16 (2H, m).

参考例192

4- [4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)ピペリジン-1-イル]フェノールの製造

参考例191で製造した1-[4-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)フェニル]-4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)ピペリジン(30.1g、68.8ミリモル)をエタノール(450ml)に懸濁し、ピリジニウムp-トルエンスルホナート(5.2g、20.6ミリモル)を加え、70℃で24時間撹拌した。エタノールを減圧留去して残渣に塩化メチレン及び飽和炭酸水

素ナトリウム水溶液を加え撹拌した。これを塩化メチレンで抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=10/1)により精製し、薄茶色粉末の4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)ピペリジン-1-イル]フェノール(22.9g、収率94%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 88-2. 02 (2H, m), 2. 06-2. 16 (2H, m), 2. 92
-3. 02 (2H, m), 3. 30-3. 39 (2H, m), 4. 36-4. 4
4 (1H, m), 4. 74 (1H, s), 6. 71-6. 78 (2H, m), 6.

10 85-6.94 (4H, m), 7.10-7.16 (2H, m)。 参考例193

ピペラジンー1-カルボン酸tert-ブチルエステル(3.94g、21.

- 6ミリモル)、2-(4-ブロモ-3-クロロフェノキシ)テトラヒドロピラン(5.61g、19.2モル)、酢酸パラジウム(86.4mg、0.39ミリモル)、BINAP(172mg、0.58ミリモル)及びtert-ブトキシナトリウム(2.4g、25.0ミリモル)を窒素雰囲気下トルエン(40ml)中にて2時間加熱還流した。反応液に酢酸エチル及び水を加え、撹拌して
- 20 沈殿物をセライト濾過により除去した後、濾液を酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(nーヘキサン/酢酸エチル=20/1)により精製し、黄色油状物質の4-[2-クロロ-4-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)フェニル]ピペラジン-1-カルボン酸
- 25 tertーブチルエステル(4.72g、収率62%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 48 (9H, s), 1. 51-2. 04 (6H, m), 2. 88-2. 93 (4H, m), 3. 56-3. 63 (5H, m), 3. 83-3. 94 (1H, m), 5. 31-5. 34 (1H, m), 6. 88-6. 96 (2H, m), 7.

10-7.13(1H, m).

参考例194

4- (2-クロロ-4-ヒドロキシフェニル) ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

5 参考例193で製造した4- [2-クロロ-4-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)フェニル]ピペラジン-1-カルボン酸tertーブチルエステル(4.73g、11.9ミリモル)をエタノール(50ml)に懸濁し、ピリジニウムp-トルエンスルホナートを触媒量加え70℃で1時間撹拌した。エタノールを減圧留去し、残渣に塩化メチレン及び飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え撹拌した。析出物を濾取後、減圧乾燥し、白色粉末の4-(2-クロロ-4-ヒドロキシフェニル)ピペラジン-1-カルボン酸tertーブチルエステル(2.68g、収率72%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 49 (9H, s), 2. 87-2. 91 (4H, m), 3. 55-3. 60 (4H, m), 5. 19 (1H, br), 6. 68-6. 74 (1H, m), 6. 88-6. 93 (2H, m).

参考例195

4- (4-アセトキシベンゾイル) ピペラジン-1-カルボン酸 tertーブチルエステルの製造

20 p-アセトキシ安息香酸(11g、61.1ミリモル)を塩化メチレン(100ml)に溶解し、DMF(3滴)及び塩化チオニル(5.54ml、76.3ミリモル)を加え2時間加熱還流した。これを氷冷しピペラジンー1ーカルボン酸tertーブチルエステル(10.3g、55.5ミリモル)及びピリジン(12ml、0.15モル)の塩化メチレン(100ml)溶液を滴下して加え、25 2時間室温で撹拌した。反応液を塩化メチレンで希釈し水、10%塩酸、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄して硫酸マグネシウムで乾燥した後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=20/1)で分離精製し、白色固体の4-(4-アセトキシベンゾイル)ピペラジン-1-カルボン酸tertーブ

チルエステル (18.5g、収率87%) を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 47 (9H, s), 2. 31 (3H, s), 3. 46 (8H, br), 7. 12-7. 18 (2H, m), 7. 41-7. 46 (2H, m).

5 参考例196

4-(4-ヒドロキシベンゾイル)ピペラジン-1-カルボン酸tertーブチルエステルの製造

参考例195で製造した4-(4-アセトキシベンゾイル) ピペラジン-1-

カルボン酸 t e r t ーブチルエステル (18.5g、53.1ミリモル) をメタ 10 ノール (200ml) に溶解し、炭酸カリウム (370mg、2.65ミリモル) を加え、室温で終夜撹拌した。反応液を減圧濃縮し、残渣に5%塩酸及び塩化メチレンを加え激しく撹拌した。析出物を濾取して水、塩化メチレンで洗浄後、減圧乾燥して、白色粉末の4-(4-ヒドロキシベンゾイル) ピペラジン-1-カルボン酸 t e r t ーブチルエステル (14.9g、収率92%) を得た。

15 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1. 48 (9H, s), 3. 46 (4H, br), 3. 60 (4H, br), 6. 75-6. 79 (2H, m), 7. 22-7. 28 (2H, m)。 参考例197

1 ーベンジルー4ー [4ー (テトラヒドロピランー2ーイルオキシ) フェニル] 20 ピペリジンー4ーオールの製造

2-(4-ブロモフェノキシ) テトラヒドロピラン (7.2g、28ミリモル)をTHF (70ml) に溶解し、-60℃に冷却した。n-ブチルリチウム (1.53M) ヘキサン溶液 (20ml、30.8ミリモル)を滴下して加え、30分撹拌した。1-ベンジル-4-ピペリドン (5.3g、28ミリモル)の THF (20ml)溶液を滴下して加え、0℃まで昇温しつつ3時間撹拌した。 反応液に塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=20/1)で分離精製し、橙色油状物質の1-ベンジル-4-[4-(テトラヒ

ドロピラン-2-イルオキシ)フェニル] ピペリジン-4-オール(5. 27g、収率 51%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 52-2. 21 (11H, m), 2. 41-2. 52 (2H, m), 2. 7

4-2. 78 (2H, m), 3. 57 (2H, s), 3. 56-3. 63 (1H, m), 3. 83-3. 96 (1H, m), 5. 39-5. 42 (1H, m), 6. 98-7. 04 (2H, m), 7. 20-7. 44 (7H, m).

参考例198

4- (4-ヒドロキシフェニル) ピペリジン-1-カルボン酸 tertーブチル

10 エステルの製造

参考例197で製造した1-ベンジル-4-[4-(テトラヒドロピラン-2 ーイルオキシ)フェニル] ピペリジンー4-オール(1.67g、4.55ミリ モル)をアセトニトリル(45m1)に溶解し、-10℃に冷却した。この冷却 液にトリエチルシラン (2.9 m 1、18.2ミリモル) 及び三フッ化ホウ素ジ エチルエーテル錯体(1.1ml、9.1ミリモル)を加え、室温で2日間撹拌 15 した。反応液に水を加え、塩化メチレンで抽出した。硫酸マグネシウムで乾燥後、 濾過し、得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をエタノール (50 m l) に 溶解し、20%水酸化パラジウム/炭素を触媒量加え、水素雰囲気下室温で終夜 撹拌した。反応液をセライト濾過し、濾液に二炭酸ジtertーブチル(1.1 m1、4.78ミリモル)を加え、室温で30分撹拌した。反応液を減圧下濃縮 20 し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール= 50/1)で分離精製し、白色固体の4-(4-ヒドロキシフェニル)ピペリジ ン-1-カルボン酸tertーブチルエステル(1.07g、収率85%)を得 た。

 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1. 41-1. 63 (2H, m), 1. 49 (9H, s), 1. 73-1. 80 (2H, m), 2. 50-2. 62 (1H, m), 2. 73-2. 83 (2H, m), 4. 19-4. 24 (2H, m), 5. 87 (1H, bs), 6. 76-6. 81 (2H, m), 7. 02-7. 08 (2H, m).

参考例199

4-[3-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)フェニル] ピペラジン-1 - カルボン酸 t e r t - ブチルエステルの製造

ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(2.94g、15.

- 5 8ミリモル)、2-(3-ブロモフェノキシ)テトラヒドロピラン(3.69g、14.4ミリモル)、酢酸パラジウム(64mg、0.29ミリモル)、BIN AP(285mg、0.43ミリモル)及びtertーブトキシナトリウム(1.8g、18.7ミリモル)を窒素雰囲気下トルエン(40ml)中にて2時間加熱還流した。反応液に酢酸エチル及び水を加え、撹拌して沈殿物をセライト濾過により除去した後、濾液を酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=20/1)により精製し、無色油状物質の4-[3-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)
- 15 収率 9 9%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 48 (9H, s), 1. 52-2. 04 (6H, m), 3. 10-3. 15 (4H, m), 3. 53-3. 64 (5H, m), 3. 87-3. 94 (1H, m), 5. 38-5. 41 (1H, m), 6. 53-6. 63 (3H, m), 7.

フェニル] ピペラジンー1ーカルボン酸tert-ブチルエステル(5.3g、

20 12-7.19 (1H, m).

参考例200

4- (3-ヒドロキシフェニル) ピペラジン-1-カルボン酸 tertーブチルエステルの製造

参考例199で製造した4-[3-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)
25 フェニル] ピペラジン-1-カルボン酸tertーブチルエステル(5.20g、14.4ミリモル)をエタノール(100ml)に懸濁し、ピリジニウムpートルエンスルホナートを触媒量加え、70℃で1.5時間撹拌した。エタノールを減圧留去し、残渣に塩化メチレン、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え撹拌した。析出物を濾取後、減圧乾燥し、淡茶色粉末の4-(3-ヒドロキシフェニ

ル) ピペラジン-1-カルボン酸 t e r t-ブチルエステル (3. 73 g、収率 93%) を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 49 (9H, s), 3. 09-3. 14 (4H, m), 3. 54-3. 59
5 (4H, m), 5. 38 (1H, br), 6. 33-6. 41 (2H, m), 6.
47-6. 52 (1H, m), 7. 08-7. 15 (1H, m).

参考例201

3-メチルー2-メチレンブチルアルデヒドの製造

ジャーナル オブ アメリカンケミカルソサイエティー、1957年p.32

10 67 (J. Am. Chem. Soc., 3267, 1957) 記載の方法に従って、3-メチルー2-メチレンブチルアルデヒドを製造した。即ち、イソバレルアルデヒド(100ml、932ミリモル)、37%ホルマリン(83.8ml、1120ミリモル)及びジメチルアミン塩酸塩(91.2g、1120ミリモル)を70℃で30時間攪拌した。水蒸気蒸留し、留分を分液し、水相からジエ

15 チルエーテルで抽出した。有機相を合わせ、硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧濃縮 した。濃縮液を蒸留して、無色液体の3-メチルー2-メチレンブチルアルデヒ ド(65.5g、収率72%)を得た。

沸点105-115℃

 $^{1}H-NMR$ (CDCl₃) δ ppm:

20 1.08(6H, d, J=6.9Hz), 2.75-2.89(1H, m), 5.95(1H, s), 6.24(1H, s), 9.53(1H, s)。 参考例202

3-メチル-2-メチレンブタン-1-オールの製造

参考例201で製造した3-メチル-2-メチレンブチルアルデヒド(65g、25 668ミリモル)のTHF(30ml)溶液を、水素化リチウムアルミニウム (14.15g、373ミリモル)のTHF(1000ml)の懸濁液に氷冷攪 拌下、滴下し、更に自然昇温させて2時間攪拌した。氷冷下、水、15%水酸化ナトリウム水溶液、水を加え、濾過して硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧濃縮し、無色液体の3-メチル-2-メチレンブタン-1-オール(61.5g、収率9

3%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 07 (6H, d, J = 6.9Hz), 1. 42 (1H, t, J = 6.1

Hz), 2. 25-2. 43 (1H, m), 4. 13 (2H, d, J=6. 1

5 Hz), 4.84-4.93 (1H, m), 4.98-5.05 (1H, m)。 参考例203

2-メトキシメトキシメチル-3-メチル-1-ブテンの製造

参考例202で製造した3-メチル-2-メチレンブタン-1-オール(61.

5g、615ミリモル)のTHF (500ml)溶液に氷冷攪拌下、クロロメチ

10 ルメチルエーテル(98ml、1292ミリモル)及びN-エチルジイソプロピルアミン(234ml、1344ミリモル)を加え、室温で22時間攪拌した。反応液を濾過し、濾液を減圧濃縮した。ジエチルエーテルを加え、水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧濃縮し、無色液体の2-メトキシメトキシメチル-3-メチル-1-ブテン(89g、定量的)を得た。

15 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1. 07 (6H, d, J=6. 9Hz), 2. 25-2. 41 (1H, m), 3. 39 (3H, s), 4. 05 (2H, s), 4. 65 (2H, s), 4. 87-4. 95 (1H, m), 5. 00-5. 05 (1H, m).

参考例204

20 2-メチレンブチルアルデヒドの製造

ブチルアルデヒド(100ml、1110ミリモル)、37%ホルマリン(9 9.8ml、1330ミリモル)及びジメチルアミン塩酸塩(108.6g、1 330ミリモル)の混合物を70℃で23時間攪拌した。水蒸気蒸留し、留分を 分液し、水相からジエチルエーテルで抽出した。有機相を合わせ、硫酸ナトリウ ムで乾燥後、減圧濃縮した。濃縮液を蒸留して、無色液体の2-メチレンブチル

25 ムで乾燥後、減圧濃縮した。濃縮液を蒸留して、無色液体の2-メチレンブチルアルデヒド(66.9g、収率72%)を得た。

沸点70-93℃

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 08 (3H, t, J = 7.5Hz), 2. 27 (2H, q, J = 7.5

Hz), 5. 98 (1H, s), 6. 25 (1H, s), 9. 56 (1H, s)。 参考例205

2-メチレン-1-ブタノールの製造

参考例204で製造した2-メチレンブチルアルデヒド(66.9g、7965)を考例204で製造した2-メチレンブチルアルデヒド(66.9g、7965)を考えた。

まリモル)を水素化リチウムアルミニウム(15.1g、398ミリモル)のTHF(1000ml)の懸濁液に氷冷攪拌下滴下し、同温度下で1時間攪拌した。水、15%水酸化ナトリウム水溶液、水を加え、濾過して硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧濃縮し、無色液体の2-メチレン-1-ブタノール(65.1g、収率95%)を得た。

- 10 ¹H-NMR (CDCl₃) δppm:
 1.07 (3H, t, J=7.5Hz), 1.44 (1H, t, J=6.0
 Hz), 2.13 (2H, q, J=7.5Hz), 4.09 (2H, d, J=6.0Hz), 4.82-4.93 (1H, m), 4.98-5.07 (1H, m)。
 参考例206
- 15 2ーメトキシメトキシメチルー1ーブテンの製造
 参考例205で製造した2ーメチレンー1ーブタノール(65.1g、757 ミリモル)のTHF(750m1)溶液に氷冷攪拌下、クロロメチルメチルエーテル(103.4m1、1363ミリモル)及びNーエチルジイソプロピルアミン(247.2m1、1419ミリモル)を加え、室温で3日間攪拌した。反応
 20 混合液を濾過し、濾液を減圧濃縮した。残渣をジエチルエーテルに溶解し、水、
- 20 混合液を濾過し、濾液を減圧濃縮した。残渣をジェナルエーナルに谷解し、水、 飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧濃縮し、無色液体の2ーメ トキシメトキシメチルー1ーブテン(98g、定量的)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 07 (3H, t, J = 7.5Hz), 2. 09 (2H, q, J = 7.5

25 Hz), 3. 38 (3H, s), 4. 01 (2H, s), 4. 64 (2H, s), 4. 86-4. 95 (1H, m), 5. 00-5. 05 (1H, m)。 参考例207

4-[2-オキソー2-(4-オキソピペリジンー1ーイル) エチル] ピペラジ 2-1-3ルボン酸 1-1 1-30 1-

1-(2-クロロアセチル)ピペリジン-4-オン(5.17g、29.4ミリモル)をアセトニトリル(50ml)に溶解した。この溶液にピペラジン-1-カルボン酸tertーブチルエステル(5.48g、29.4ミリモル)及びN-エチルジイソプロピルアミン(6.2ml、35.3ミリモル)を加え、2時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=100/1)で精製して淡黄色固体の4-[2-オキソー2-(4-オキソピペリジン-1-イル)エチル]ピペラジン-1-カルボン酸

10 tertーブチルエステル(6.49g、収率68%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

- 1. 46 (9H, s), 2. 44-2. 54 (8H, m), 3. 28 (2H,
- s), 3. 42-3. 47 (4H, m), 3. 85-3. 90 (4H, m)。 参考例208
- 15 酢酸 4 ーメチルー 4 ーペンテニルエステルの製造

メチルトリフェニルホスホニウムブロミド (30g、84ミリモル)及びTHF (300ml) の混合物に tertーブトキシカリウム (9.4g、84ミリモル)を加え、室温下にて40分撹拌した。氷冷下にて酢酸4ーオキソペンチルエステル (9.9g、68.8ミリモル)をTHF (30ml) に溶解した溶液を

- 20 徐々に滴下し、室温下にて2時間撹拌した。反応液を氷水中に注ぎ、ジェチルエーテルにより2回抽出した。有機相を合わせ、飽和食塩水により洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し(nーヘキサン/酢酸エチル=4/1)、無色オイルの酢酸4ーメチルー4ーペンテニルエステル(5.9g、収率25 60.4%)を得た。
- ¹H-NMR (CDCl₃) δppm:
 - 1. 70-1. 86 (5H, m), 2. 00-2. 14 (5H, m), 4. 07 (2H, t, J=6. 7Hz), 4. 69 (1H, s), 4. 74 (1H, s)。 参考例209

4- (2-メチル-2-オキシラニルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸ベンジルエステルの製造

水素化ナトリウム (0.37g、9.32ミリモル) のDMSO (20ml) 懸濁液に氷冷攪拌下、トリメチルスルホキソニウムヨージド (1.96g、8.

- 5 91ミリモル)を加え、室温で30分間攪拌し、4-(2-オキソプロピル)ピペラジン-1-カルボン酸ベンジルエステル(2.24g、8.10ミリモル)のDMSO(10m1)溶液を加え、更に室温で1時間攪拌した。氷水に注ぎ、ジエチルエーテルで抽出し、水で洗浄して硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。微黄色液体の4-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)ピペラジン-
- 10 1-カルボン酸ベンジルエステル (1.51g、収率64%) を得た。

 ¹H-NMR (CDCl₃) δ p p m:
 - 1. 37 (3H, s), 2. 27-2. 63 (8H, m), 3. 44-3. 63 (4H, m), 5. 13 (2H, s), 7. 29-7. 44 (5H, m)。 参考例210
- 15 4-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)ホモピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

水素化ナトリウム (4.3g、109ミリモル)をDMSO(200m1)に 懸濁し、トリメチルスルホキソニウムヨージド(22.95g、104ミリモル)を徐々に加え、室温下にて2時間撹拌した。得られる混合物に、参考例10

- 20 で製造した4-(2-オキソプロピル)ホモピペラジン-1-カルボン酸 tertーブチルエステル(24.3g、94.8ミリモル)をDMSO(25 m1)に溶解した溶液を徐々に滴下し、室温下にて1時間撹拌した。反応液を氷水中に注ぎ、ジエチルエーテルにより抽出し、硫酸マグネシウムにより乾燥した。 濾過後、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ
- 25 ーにより精製し(塩化メチレン/メタノール=100/1)、微黄色オイルの4 ー (2-メチルー2-オキシラニルメチル)ホモピペラジンー1-カルボン酸 tert-ブチルエステル(15.38g、収率60%)を得た。
 - ¹H-NMR (CDCl₃) δppm:
 - 1. 38(3H, s), 1. 43(9H, s), 1. 69-1. 90(2H,

m), 2. 40-2. 75 (8H, m), 3. 36-3. 55 (4H, m)。 参考例211

4-[2-(2-x+v-2-x+v-z-v)] ピペラジン-1-xン酸 t e r t - x

5 窒素雰囲気下、水素化ナトリウム(1.2g、35ミリモル)をDMSO(120ml)に懸濁し、トリメチルスルホキソニウムヨージド(7.8g、35ミリモル)を徐々に加え、室温下にて2時間撹拌した。得られる混合物に、4ー(3-オキソブチル)ピペラジン-1-カルボン酸tertーブチルエステル

(6.1g、23.8ミリモル)をDMSO(10ml)に溶解した溶液を徐々

- 10 に滴下し、室温下にて1.5時間撹拌後、50~60℃にて1.5時間撹拌した。 反応液を室温に戻し、氷水中に注ぎ、酢酸エチルにより3回抽出した。有機相を 合わせ、3回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。 濾過後、濾液を減圧下にて濃縮し、微黄色オイルの4-[2-(2-メチル-2 ーオキシラニル)エチル]ピペラジン-1-カルボン酸tertーブチルエステ
- 15 ル (5.6g、収率87%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

- 1. 33 (3H, s), 1. 46 (9H, s), 1. 66-1. 85 (2H, m), 2. 28-2. 50 (6H, m), 2. 55-2. 66 (2H, m), 3. 34-3. 47 (4H, m).
- 20 参考例212

1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジンの製造

ジメチルスルホキシド(30ml)に水素化ナトリウム(484mg、12.1ミリモル)を懸濁させた。この懸濁液にトリメチルスルホキソニウムヨージド (2.5g、11.6ミリモル)を少しずつ加え、室温で1時間撹拌した。得られる混合物に、1-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジン-1-イル]プロパン-2-オン(3.4g、11.9ミリモル)をジメチルスルホキシド(20ml)に溶解した溶液を加え、室温で1時間撹拌した。反応液を氷水に注ぎ、ジエチルエーテル抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグ

ネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカ ゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=100/1)によ り精製し、淡黄色粉末の1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジン(3.2g、収率98%)を得

5 た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

- 1. 40 (3H, s), 2. 33 (1H, d, J=13.0Hz), 2. 53-
- 2. 73 (7H, m), 3. 26-3. 30 (4H, m), 6. 91 (2H, d, J=8. 7Hz), 7. 47 (2H, d, J=8. 7Hz).
- 10 参考例212と同様にして、参考例213~参考例217の化合物を製造した。 参考例213

1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-(4-ビフェニリル) ピペラジン

淡黄色粉末、収率99%

- 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:
 - 1. 41 (3H, s), 2. 37 (1H, d, J=12. 9Hz), 2. 58-2. 76 (7H, m), 3. 23-3. 28 (4H, m), 6. 97-7. 01 (2H, m), 7. 24-7. 30 (1H, m), 7. 37-7. 43 (2H, m), 7. 49-7. 58 (4H, m).
- 20 参考例214

1- (2-メチル-2-オキシラニルメチル) -4- (4-クロロフェニル) ピペラジン

淡黄色粉末、収率99%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

25 1. 39 (3H, s), 2. 34 (1H, d, J=12. 9Hz), 2. 54-2. 73 (7H, m), 3. 14-3. 18 (4H, m), 6. 81-6. 87 (2H, m), 7. 16-7. 22 (2H, m).

参考例215

1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-(4-トリフルオロメトキ

シフェニル) ピペラジン

淡黄色粉末、収率99%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 40 (3H, s), 2. 34 (1H, d, J=12.9Hz), 2. 54-

5 2. 73 (7H, m), 3. 16-3. 20 (4H, m), 6. 85-6. 92 (2H, m), 7. 08-7. 13 (2H, m).

参考例216

1- (2-メチル-2-オキシラニルメチル) -4- (ピリジン-2-イル) ピペラジン

10 淡黄色粉末、収率99%

 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1. 41 (3H, s), 2. 35 (1H, d, J=12. 9Hz), 2. 50-2. 69 (7H, m), 3. 48-3. 60 (4H, m), 6. 59-6. 66

(2H, m), 7. 43-7. 50 (1H, m), 8. 17-8. 20 (1H,

15 m) .

参考例217

1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-(ピリミジン-2-イル) ピペラジン

淡黄色粉末、収率99%

 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1. 41 (3H, s), 2. 36 (1H, d, J=12.9Hz), 2. 45-

2. 64 (7H, m), 3. 81-3. 85 (4H, m), 6. 47 (1H, t,

J = 4.8 Hz), 8.30 (2H, d, J = 4.8 Hz).

参考例218

ジメチルスルホキシド (20m1) に水素化ナトリウム (372mg、9.3 2 1 2 1 1 2 1 1 2 1 1 2 1 1 2 1 1 2 1 1 2 1

得られる混合物に、Nーメチルー [1-(2-オキソプロピル) ピペリジンー4 ーイル] カルバミン酸 t e r t ーブチルエステル (2.3 g、8.5ミリモル) をジメチルスルホキシド (20ml) に溶解した溶液を加え、室温で2時間撹拌した。反応液を氷水に注ぎ、ジエチルエーテル抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=100/1) により精製し、淡黄色油状物質のNーメチルー [1-(2-メチルー2-オキシラニルメチル) ピペリジンー4ーイル] カルバミン酸 t e r t ーブチルエステル (2.1 g、収率86%) を得た。

10 ¹H-NMR (CDCl₃) δ p p m:
1. 36 (3H, s), 1. 46 (9H, s), 1. 55-1. 79 (5H, m), 1. 97-2. 13 (2H, m), 2. 30 (1H, d, J=12. 9 Hz), 2. 49 (1H, d, J=12. 9Hz), 2. 59 (2H, s), 2. 74 (3H, s), 2. 88-3. 06 (2H, m)。

15 参考例219

3-(2-メチル-2-オキシラニル)ピリジンの製造

3-アセチルピリジン(8 g、6 6. 1 ミリモル)を用い、参考例 2 1 8 と同様にして、淡茶オイルの 3- (2-メチル-2-オキシラニル)ピリジン(7 g、収率 7 8 . 4 %)を得た。

- 1 H-NMR (CDCl₃) δ p p m: 1. 74 (3H, s), 2. 82 (1H, d, J=5. 2Hz), 3. 02 (1 H, d, J=5. 2Hz), 7. 21-7. 33 (1H, m), 7. 58-7. 70 (1H, m), 8. 54 (1H, dd, 1. 6Hz, 4. 8Hz), 8. 6 5 (1H, d, J=2. 3Hz) 。
- 25 参考例 2 2 0

1-オキサー6-アザスピロ [2, 5] オクタンー6-カルボン酸 tert t-ブ チルエステルの製造

ジメチルスルホキシド(600ml)に水素化ナトリウム(13.3g、0.33モル)を懸濁させた。この懸濁液にトリメチルスルホキソニウムヨージド

5 硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮し、残渣を n - へキサンで結晶化して白色粉末の1-オキサー6-アザスピロ [2,5] オクタンー6-カルボン酸tert-ブチルエステル(61.7g、収率96%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

10 1. 40-1. 53 (2H, m), 1. 47 (9H, s), 1. 72-1. 85 (2H, m), 2. 69 (2H, s), 3. 37-3. 48 (2H, m), 3. 67-3. 77 (2H, m).

参考例221

4-[2-(1-オキサー6-アザスピロ[2,5]オクタンー6-イル)-2
15 ーオキソエチル]ピペラジン-1-カルボン酸tertーブチルエステルの製造ジメチルスルホキシド(50ml)に水素化ナトリウム(385mg、9.64ミリモル)を懸濁させた。この懸濁液にトリメチルスルホキソニウムヨージド(2.02g、9.20ミリモル)を少しずつ加え、室温で1時間撹拌した。得られる混合物に、4-[2-オキソー2-(4-オキソピペリジン-1-イル)

- エチル] ピペラジン-1-カルボン酸tertーブチルエステル(2.85g、8.76ミリモル)のDMSO(10ml)溶液を加え、室温で2時間、55℃で1時間撹拌した。反応液を氷水に注ぎ込み、ジエチルエーテル抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮し、白色固体の4-[2-(1-オキサ-6-アザスピロ[2,
- 25 5] オクタン-6-イル) -2-オキソエチル] ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (2.97g、収率99%) を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 45-1. 54 (2H, m), 1. 48 (9H, s), 1. 78-1. 93 (2H, m), 2. 44-2. 49 (4H, m), 2. 62 (2H, s), 2.

73 (2H, s), 3. 15-3. 36 (2H, m), 3. 42-3. 47 (2H, m), 3. 52-3. 68 (1H, m), 3. 77-3. 88 (1H, m), 4. 02-4. 22 (2H, m).

参考例222

5 6-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1-オキサー6-アザスピロ[2,5]オクタンの製造

ジメチルスルホキシド (30m1) へ水素化ナトリウム (361mg、9.02ミリモル) を懸濁させた。この懸濁液にトリメチルスルホキソニウムヨージド (2.00g、9.02ミリモル) を少しずつ加え、室温で1時間撹拌した。得 6れる混合物に、1-(4-トリフルオロメチルフェニル) ピペリジンー4ーオン (2.00g、8.2ミリモル) のDMSO (10m1) 溶液を加え、室温で終夜撹拌した。反応液を氷水に注ぎ、ジエチルエーテル抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=5/1) により精製し、淡黄色固体の6-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1ーオキサー6-アザスピロ[2,5] オクタン (1.51g、収率72%) を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 54-1. 65 (2H, m), 1. 91-2. 04 (2H, m), 2. 54

20 -2. 59 (2H, m), 2. 73 (2H, s), 3. 38-3. 48 (1H, m), 3. 52-3. 62 (1H, m), 6. 95 (2H, d, J=8. 7 Hz), 7. 48 (2H, d, J=8. 7Hz).

参考例223

酢酸3-(2-メチル-2-オキシラニル)プロピルエステルの製造

25 参考例208で製造した酢酸4-メチル-4-ペンテニルエステル(5.9g、41.5ミリモル)及び塩化メチレン(60ml)の混合物に、氷冷下にてm-クロロ過安息香酸(12.3g、71.30ミリモル)を徐々に加え、室温下にて2時間撹拌した。氷冷下にて飽和亜硫酸ナトリウム水溶液、飽和炭酸ナトリウム水溶液を加え、30分撹拌後、分液した。水相をさらに塩化メチレンにより抽

出した。有機相を合わせ、飽和重曹水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧下にて濃縮し、無色オイルの酢酸3ー(2-メチル-2-オキシラニル)プロピルエステル(6.9g、定量的)を得た。

5 ¹H-NMR (CDCl₃) δ p p m: 1. 33 (3H, s), 1. 56-1. 79 (4H, m), 2. 05 (3H, s), 2. 56-2. 70 (2H, m), 4. 08 (2H, t, J=6. 5 Hz)₀

参考例224

10 1-エチル-5-[2-(2-メチル-2-オキシラニル) エチル] -1H-テトラゾールの製造

1-エチル-5- (3-メチル-3-ブテニル) -1H-テトラゾール (0.95g、5.71ミリモル) の塩化メチレン (20m1) 溶液に氷冷攪拌下、m

ークロロ過安息香酸(1.97g、7.99ミリモル)を少量ずつ加え、更に室

- 15 温で21時間攪拌した。反応混合液にチオ硫酸ナトリウム水溶液と炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、濾過して塩化メチレン相を炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸マグネシムで乾燥後、減圧濃縮した。微黄色液体の1-エチル-5-[2-(2-メチル-2-オキシラニル)エチル]-1H-テトラゾール(1.2g、定量的)を得た。
- 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1. 40 (3H, s), 1. 55 (3H, t, J = 7. 3Hz), 2. 00-2.

16 (1H, m), 2.20-2.37 (1H, m), 2.66 (2H, s),

2. 78-2. 98 (2H, m), 4. 32 (2H, q, J=7. 3Hz).

対応する出発原料を用い、参考例224と同様にして、参考例225及び参考

25 例226の化合物を製造した。

参考例225

1-7 1-7

収率100%

 $^{1}H-NMR$ (CDCl₃) δ ppm:

1. 32 (3H, s), 2. 01-2.28 (2H, m), 2. 59 (2H, m)

s), 2. 92-2. 99 (2H, m), 7. 43-7. 47 (2H, m), 7.

58-7.63(3H, m).

5 参考例 2 2 6

収率100%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

10 1. 33 (3H, s), 2. 00-2. 12 (1H, m), 2. 19-2. 31 (1H, m), 2. 60 (2H, s), 2. 90-2. 97 (2H, m), 7. 39-7. 45 (2H, m), 7. 56-7. 62 (2H, m)。
参考例227

1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1, 4-ジヒドロベンゾ [d]

15 [1, 3] オキサジン-2-オンの製造

1-(2-メチル-2-プロペニル)-1,4-ジヒドロベンゾ [d] [1,3] オキサジン-2-オン(7.09g、34.88ミリモル)の塩化メチレン(150ml)溶液にm-クロロ過安息香酸(13.76g,55.81ミリモル)を加え、室温で24時間攪拌した。チオ硫酸ナトリウム水溶液及び炭酸水素

20 ナトリウム水溶液を加え、濾過して塩化メチレン相を炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸マグネシムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=4/1) により精製し、微黄色液体の1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1,4-ジヒドロベンゾ[d][1,3]オキサジン-2-オン(5.13g、67%)を得た。

 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1. 39 (3H, s), 2. 70 (1H, d, J=4. 4Hz), 2. 78 (1 H, d, J=4. 4Hz), 3. 79 (1H, d, J=15. 5Hz), 4. 5 1 (1H, d, J=15. 5Hz), 5. 23 (2H, s), 7. 04-7. 1 3 (2H, m), 7. 21-7. 27 (1H, m), 7. 29-7. 38 (1H,

m)。

5

参考例228

3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-3H-ベンブオキサゾール-2 -オンの製造

3-(2-メチル-2-プロペニル)-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン

(1.66g、8.77ミリモル)及び塩化メチレン(30m1)の混合物に、 水冷下にてm-クロロ過安息香酸(1.66g、9.65ミリモル)を加え、室 温下にて終夜撹拌した。反応液を濾過し、濾液を20%亜硫酸ナトリウム水溶液、 飽和重曹水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した。濾過 10後、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣を塩化メチレン/n-ヘキサンにより処理 し、析出晶を濾取することにより白色粉末の3-(2-メチル-2-オキシラニ ルメチル)-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン(1.78g、収率99%) を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

15 1.38(3H, s), 2.73(1H, d, J=4.3Hz), 2.81(1H, d, J=4.3Hz), 2.81(1H, d, J=4.3Hz), 3.68(1H, d, J=15.0Hz), 4.2
6(1H, d, J=15.0Hz), 7.09-7.29(4H, m)。
対応する出発原料を用い、参考例228と同様にして、参考例229~参考例232の化合物を製造した。

20 参考例 2 2 9

5-クロロー3-(2-メチルー2-オキシラニルメチル)-3H-ベンゾオキ サゾール-2-オン

収率93%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

25 1. 38 (3H, s), 2. 75 (1H, d, J=4. 2Hz), 2. 79 (1 H, d, J=4. 2Hz), 3. 60 (1H, d, J=15. 1Hz), 4. 2 8 (1H, d, J=15. 1Hz), 7. 05-7. 16 (2H, m), 7. 2 0-7. 27 (1H, m)

参考例 2 3 0

5-フルオロ-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-3H-ベンゾオ キサゾール-2-オン

収率97%

 $^{1}H-NMR$ (CDCl₃) δ ppm:

- 5 1. 38 (3H, s), 2. 75 (1H, d, J=4. 3Hz), 2. 80 (1 H, d, J=4. 3Hz), 3. 60 (1H, d, J=15. 1Hz), 4. 2 9 (1H, d, J=15. 1Hz), 6. 75-6. 85 (1H, m), 7. 0 1 (1H, dd, J=2. 6Hz, 7. 9Hz), 7. 13 (1H, dd, J= 4. 2Hz, 8. 8Hz).
- 10 参考例231

5-フェニル-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-3H-ベンゾオ キサゾール-2-オン

収率92%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

- 15 1. 40 (3H, s), 2. 74 (1H, d, J=4. 3Hz), 2. 82 (1 H, d, J=4. 3Hz), 3. 70 (1H, d, J=15. 0Hz), 4. 3 2 (1H, d, J=15. 0Hz), 7. 25 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 29-7. 49 (5H, m), 7. 57 (2H, dd, J=1. 6Hz, 8. 5Hz)
- 20 参考例 2 3 2

5-ブロモ-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-3H-ベンゾオキ サゾール-2-オン

収率80%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

25 1. 38 (3H, s), 2. 75 (1H, d, J=4. 2Hz), 2. 79 (1H, d, J=4. 2Hz), 3. 61 (1H, d, J=15. 1Hz), 4. 2 7 (1H, d, J=15. 1Hz), 7. 08 (1H, d, J=8. 5Hz), 7. 18-7. 31 (1H, m), 7. 38 (1H, d, J=1. 9Hz)。参考例233

5

1- (2-メチル-2-オキシラニルメチル) -3-フェニル-1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オンの製造

1-(2-メチルー2-プロペニル)-3-フェニルー1, 3-ジヒドロベン ゾイミダゾールー2-オン(720mg、2.72ミリモル)を用い、参考例228と同様にして、微黄色オイルの1-(2-メチルー2-オキシラニルメチル)-3-フェニルー1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾールー2-オン(758mg、収率99%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 40 (3H, s), 2. 73 (1H, d, J=4.5Hz), 2. 86 (1

10 H, d, J=4.5Hz), 3.82 (1H, d, J=15.0Hz), 4.3 8 (1H, d, J=15.0Hz), 7.02-7.30 (4H, m), 7.3 4-7.45 (1H, m), 7.50-7.57 (4H, m)

対応する出発原料を用い、参考例233と同様にして、参考例234~参考例245の化合物を製造した。

15 参考例234

1-(4-7)ルオロフェニル)-3-(2-3) チルー2-3 キシラニルメチル)-1, 3-3 ドロベンゾイミダゾールー2-3 収率9.6 %

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

20 1. 40 (3H, s), 2. 73 (1H, d, J=4. 5Hz), 2. 85 (1 H, d, J=4. 5Hz), 3. 81 (1H, d, J=15. 0Hz), 4. 3 8 (1H, d, J=15. 0Hz), 7. 00-7. 30 (6H, m), 7. 4 3-7. 57 (2H, m).

参考例235

25 1-(1-tert-ブトキシカルボニルピペリジン-4-イル) -3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル) -1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール<math>-2-オン

収率40%

1. 34 (3H, s), 1. 54 (9H, s), 1. 71-1. 87 (2H, m), 2. 20-2. 42 (2H, m), 2. 70 (1H, d, J=4. 5 Hz), 2. 71-2. 89 (3H, m), 3. 75 (1H, d, J=15. 0 Hz), 4. 20-4. 53 (4H, m), 7. 00-7. 13 (3H, m), 7. 15-7. 25 (1H, m)

参考例236

1-メチル-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン

収率68%

5

- 10 ¹H-NMR (CDCl₃) δ p pm:
 1. 34 (3H, s), 2. 69 (1H, d, J=4. 5Hz), 2. 78 (1 H, d, J=4. 5Hz), 3. 44 (3H, s), 3. 76 (1H, d, J=15. 0Hz), 4. 31 (1H, d, J=15. 0Hz), 6. 91-7. 0
 0. (1H, m), 7. 05-5. 25 (3H, m)
- 5 参考例237
 5-クロロー1ーメチルー3ー(2ーメチルー2ーオキシラニルメチル)ー1,
 3-ジヒドロベンゾイミダゾールー2ーオン
 収率89%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

- 20 1. 34 (3H, s), 2. 70 (1H, d, J=4. 4Hz), 2. 76 (1 H, d, J=4. 4Hz), 3. 42 (3H, s), 3. 69 (1H, d, J=15. 1Hz), 4. 28 (1H, d, J=15. 1Hz), 6. 88 (1H, d, J=8. 3Hz), 7. 09 (1H, dd, J=1. 9Hz, 8. 3Hz), 7. 22 (1H, d, J=1. 9Hz),
- 25 参考例 2 3 8

1-メチル-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-5-トリフルオロメチル-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン

収率99%

- 1. 36 (3H, s), 2. 71 (1H, d, J=4. 4Hz), 2. 77 (1H, d, J=4. 4Hz), 3. 47 (3H, s), 3. 74 (1H, d, J=15. 1Hz), 4. 38 (1H, d, J=15. 1Hz), 7. 04 (1H, d, J=8. 2Hz), 7. 39 (1H, dd, J=1. 9Hz, 8. 2Hz).
- 5 7.45 (1H, d, J=1.9Hz).

参考例239

6-クロロー1-メチルー3-(2-メチルー2-オキシラニルメチル)-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾールー2-オン

収率99%

- 10 ¹H-NMR (CDCl₃) δ p p m:
 1. 32 (3H, s), 2. 69 (1H, d, J=4. 6Hz), 2. 75 (1 H, d, J=4. 6Hz), 3. 41 (3H, s), 3. 68 (1H, d, J=15. 1Hz), 4. 33 (1H, d, J=15. 1Hz), 6. 97 (1H,
 - d, J=1.9Hz), 7.07 (1H, dd, J=1.9Hz, 8.4Hz),
- 15 7.13 (1H, d, J=8.4Hz).

参考例240

5-フルオロ-1-メチルー3-(2-メチルー2-オキシラニルメチル)-1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾールー2-オン 収率6.6%

- 20 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:
 - 1. 34 (3H, s), 2. 70 (1H, d, J=4. 4Hz), 2. 77 (1H, d, J=4. 4Hz), 3. 42 (3H, s), 3. 77 (1H, d, J=15. 0Hz), 4. 33 (1H, d, J=15. 0Hz), 6. 74-6. 9 1 (2H, m), 7. 00 (1H, dd, J=2. 2Hz, 8. 6Hz) \circ
- 25 参考例 2 4 1

5-クロロー1-エチルー3-(2-メチルー2-オキシラニルメチル)-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾールー2-オン

収率100%

1. 25-1. 39 (6H, m), 2. 70 (1H, d, J=4. 4Hz), 2. 76 (1H, d, J=4. 4Hz), 3. 69 (1H, d, J=15. 1Hz), 3. 93 (2H, q, J=7. 3Hz), 4. 30 (1H, d, J=15. 1Hz), 4. 30, 6. 90 (1H, d, J=8. 3Hz), 7. 07 (1H, dd, J=

5 2.0 Hz, 8.3 Hz), 7.23 (1 H, d, J = 2.0 Hz).

参考例242

5 ークロロー1ーイソプロピルー3ー (2ーメチルー2ーオキシラニルメチル) ー1,3ージヒドロベンゾイミダゾールー2ーオン 収率100%

- 10 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:
 - 1. 34 (3H, s), 1. 53 (6H, dd, J=2. 1Hz, 6. 7Hz),
 2. 70 (1H, d, J=4. 5Hz), 2. 75 (1H, d, J=4. 5
 Hz), 3. 68 (1H, d, J=15. 1Hz), 4. 28 (1H, d, J=
 15. 1Hz), 4. 65-4. 79 (1H, m), 7. 04 (2H, s), 7.
- 15 22 (1H, s).

参考例243

5-ジメチルアミノー1-メチルー3-(2-メチルー2-オキシラニルメチル)-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾールー2-オン 収率<math>100%

- 1 H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:
 - 1. 33 (3H, s), 2. 69 (1H, d, J=4. 5Hz), 2. 79 (1 H, d, J=4. 5Hz), 2. 92 (6H, s), 3. 39 (3H, s), 3. 67 (1H, d, J=15. 0Hz), 4. 32 (1H, d, J=15. 0 Hz), 6. 55 (1H, dd, J=2. 4Hz, 8. 6Hz), 6. 71 (1
- 25 H, d, J=2.4Hz), 6.85(1H, d, J=8.6Hz)。 参考例244

 $5-クロロ-1-(n- \wedge + シル) -3-(2- メチル-2- オキシラニルメチル) -1, 3- ジヒドロベンゾイミダゾール-2- オン 収率<math>100\%$

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

0. 87 (3H, t, J = 6.9Hz), 1. 18-1. 43 (9H, m), 1.

64-1.80(2H, m), 2.70(1H, d, J=4.4Hz), 2.7

5 (1H, d, J=4.4Hz), 3.69 (1H, d, J=15.0Hz),

5 3.86 (2H, t, J=7.4Hz), 4.30 (1H, d, J=15.0 Hz), 6.88 (1H, d, J=8.4Hz), 7.06 (1H, dd, J= 1.9Hz, 8.4Hz), 7.22 (1H, d, J=1.9Hz).

参考例 2 4 5

5-エトキシカルボニルー1-メチルー3-(2-メチルー2-オキシラニルメ

10 チル) -1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾールー2-オン

収率100%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 32-1. 43 (6 H, m), 2. 69 (1 H, d, J=4. 5Hz), 2. 78 (1 H, d, J=4. 5Hz), 3. 47 (3 H, s), 3. 87 (1 H,

15 d, J=15.0Hz), 4.28 (1H, d, J=15.0Hz), 4.39 (2H, q, J=7.2Hz), 7.00 (1H, d, J=8.2Hz), 7.85 (1H, d, J=1.5Hz), 7.90 (1H, dd, J=1.5Hz, 8.2Hz),

参考例246

20 1 ーベンジルー3 ー (2 ーメチルー2 ーオキシラニルメチル) イミダゾリジンー 2 ーオンの製造

1-ベンジルー3-(2-メチルー2-プロペニル)イミダゾリジンー2-オン (1.63g、7.05ミリモル)を用い、参考例228と同様にして、微黄 色オイルの1-ベンジルー3- (2-メチルー2-オキシラニルメチル)イミダ

25 ゾリジン-2-オン(680mg、収率39%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 35 (3H, s), 2. 62 (1H, d, J=4.7Hz), 2. 69 (1H, d, J=4.7Hz), 3. 05-3.25 (3H, m), 3. 27-3.49 (2H, m), 3. 61 (1H, d, J=14.6Hz), 4. 39 (2H, m)

s), 7.20-7.34(5H, m).

対応する出発原料を用い、参考例246と同様にして、参考例247~参考例250の化合物を製造した。

参考例247

5 1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-3-フェニルイミダゾリジン-2-オン

収率58%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 37 (3H, s), 2. 65 (1H, d, J=4. 6Hz), 2. 72 (1

10 H, d, J=4.6Hz), 3.18 (1H, d, J=14.7Hz), 3.4 8-3.61 (2H, m), 3.64 (1H, d, J=14.7Hz), 3.7 7-3.91 (2H, m), 7.03 (1H, t, J=7.3Hz), 7.25 -7.36 (2H, m), 7.56 (2H, d, J=7.9Hz).

参考例 2 4 8

15 1 - (4 - フルオロベンジル) - 3 - (2 - メチル - 2 - オキシラニルメチル) イミダゾリジン - 2 - オン

収率34%

 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1. 35 (3H, s), 2. 62 (1H, d, J=4. 7Hz), 2. 68 (1

20 H, d, J=4. 7Hz), 3. 12 (1H, d, J=14.6Hz), 3. 1 6-3. 20 (2H, m), 3. 27-3. 45 (2H, m), 3. 61 (1H, d, J=14.6Hz), 4. 35 (2H, s), 6. 89-7. 07 (2H,

m), 7. 14-7. 27 (2H, m).

参考例249

25 1- (4-ブロモベンジル) -3- (2-メチル-2-オキシラニルメチル) イ ミダゾリジン-2-オン

収率5.1%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 34 (3H, s), 2. 62 (1H, d, J=4. 7Hz), 2. 67 (1

H, d, J=4.7Hz), 3. 12 (1H, d, J=14.7Hz), 3. 1 6-3. 25 (2H, m), 3. 27-3. 50 (2H, m), 3. 61 (1H, d, J=14.7Hz), 4. 33 (2H, s), 7. 15 (2H, d, J=8.4Hz), 7. 45 (2H, d, J=8.4Hz).

5 参考例 2 5 0

 $1 - (4 - \lambda + 2 - \lambda$

収率43%

 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

10 1. 34 (3H, s), 2. 61 (1H, d, J=4. 7Hz), 2. 67 (1 H, d, J=4. 7Hz), 3. 07-3. 23 (3H, m), 3. 27-3. 50 (2H, m), 3. 58 (1H, d, J=14. 6Hz), 3. 80 (3H, s), 4. 32 (2H, s), 6. 86 (2H, d, J=8. 4Hz), 7. 1 9 (2H, d, J=8. 4Hz).

15 参考例 2 5 1

25

1-(4-クロロベンジル)-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)イミダゾリジン-2-オンの製造

トルエン-4-スルホン酸2-メチル-2-オキシラニルメチルエステル(5

00mg、2.37ミリモル)をDMF5mlに溶解し、氷冷下にて水素化ナト 20 リウム (99mg、2.49ミリモル)を加え、室温下にて1時間撹拌した。1ー(4ークロロベンジル) イミダゾリジンー2ーオン (633mg、2.61ミリモル)をDMF5mlに溶解した溶液を氷冷下にて加え、室温下にて終夜撹拌した。反応液に水を加え、ジエチルエーテルにより2回抽出した。有機相を合わせ、2回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。濾

過後、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー $(n-\alpha+ + \nu)/$ アセトン= 3/1)により精製し、微黄色オイルの $1-(4-2 - \nu)/$ 0 $1-(2-\nu)/$ 2 $1-(2-\nu)/$ 2 $1-(2-\nu)/$ 3 $1-(2-\nu)/$ 3 $1-(2-\nu)/$ 2 $1-(2-\nu)/$ 3 $1-(2-\nu)/$ 3 $1-(2-\nu)/$ 3 $1-(2-\nu)/$ 3 $1-(2-\nu)/$ 6 $1-(2-\nu)/$ 6 $1-(2-\nu)/$ 7 $1-(2-\nu)/$ 7 $1-(2-\nu)/$ 7 $1-(2-\nu)/$ 7 $1-(2-\nu)/$ 9 $1-(2-\nu)/$ 9

1. 35 (3H, s), 2. 62 (1H, d, J=4. 7Hz), 2. 68 (1 H, d, J=4. 7Hz), 3. 05-3. 25 (3H, m), 3. 27-3. 49 (2H, m), 3. 61 (1H, d, J=14. 7Hz), 4. 35 (2H, s), 7. 21 (2H, dd, J=2. 0Hz, 6. 7Hz), 7. 30 (2H, dd, J=2. 0Hz, 6. 7Hz),

対応する出発原料を用い、参考例251と同様にして、参考例252及び参考例253の化合物を製造した。

参考例252

1-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-3-(2-メチル-2-オキシラ

10 ニルメチル) イミダゾリジンー2ーオン

収率54%

 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1. 35 (3H, s), 1. 59-1. 80 (4H, m), 2. 00-2. 16 (2H, m), 2. 60 (1H, d, J=4.7Hz), 2. 66 (1H, d, J=4.7Hz)

15 J=4.7Hz), 2. 84-3.00(2H, m), 3. 07(1H, d, J)= 14.7Hz), 3. 22-3.43(4H, m), 3. 50(2H, s), 3. 54(1H, d, J=14.7Hz), 3. 68-3.86(1H, m), 7. 16-7.34(5H, m).

参考例 2 5 3

20 1-(2, 4-ジメトキシベンジル)-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル) イミダゾリジン-2-オン

収率40%

¹H-NMR (CDC1₃) δppm:

1. 34 (3H, s), 2. 60 (1H, d, J=4. 7Hz), 2. 67 (1

25 H, d, J=4. 7Hz), 3. 10 (1H, d, J=14. 6Hz), 3. 1 4-3. 34 (4H, m), 3. 56 (1H, d, J=14. 6Hz), 3. 8 0 (6H, s), 4. 35 (2H, s), 6. 32-6. 43 (2H, m), 7. 18 (1H, d, J=8. 9Hz).

参考例 2 5 4

1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)ピロリジン-2,5-ジオンの製造

1-(2-メチル-2-プロペニル)ピロリジン-2, 5-ジオンを用い、参考例228と同様にして、<math>1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)ピロリジン-2, 5-ジオンを製造した。

収率86%

 $^{1}H-NMR$ (DMSO-d₆) δ ppm:

1. 34 (3H, s), 2. 58 (1H, d, J=4.6Hz), 2. 67-2. 79 (5H, m), 3. 56 (1H, d, J=13.9Hz), 3. 84 (1H, d, J=13.9Hz)

10 d, J = 1 3.9 Hz).

参考例255

2- (2-メチル-2-オキシラニルメチル) フタルイミドの製造

2- (2-メチル-2-プロペニル) フタルイミドを用い、参考例228と同様にして、2- (2-メチル-2-オキシラニルメチル) フタルイミドを製造し

収率 9 8 %

た。

15

¹H-NMR (DMSO-d₆) δppm:

1. 38 (3H, s), 2. 62 (1H, d, J=4.6Hz), 2. 82 (1H, d, J=4.6Hz), 3. 71 (1H, d, J=14.3Hz), 4. 0

20 1 (1H, d, J=14.3Hz), 7.73 (2H, dd, J=2.9Hz, 8.6Hz), 7.87 (2H, dd, J=2.9Hz, 8.6Hz)。 参考例256

1- (2-メチル-2-オキシラニルメチル) -1H-ベンゾイミダゾールの製造

収率11%

1. 32 (3H, s), 2. 60 (1H, d, J=4. 4Hz), 2. 71 (1 H, d, J=4. 4Hz), 4. 17 (1H, d, J=15. 1Hz), 4. 4 4 (1H, d, J=15. 1Hz), 7. 23-7. 41 (2H, m), 7. 4 8 (1H, dd, J=2. 2Hz, 7. 8Hz), 7. 80 (1H, dd, J= 2. 2Hz, 7. 8Hz), 7. 93 (1H, s).

参考例257

収率53%

10

15

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 26 (3H, s), 2. 57 (1H, d, J=4. 4Hz), 2. 69 (1 H, d, J=4. 4Hz), 3. 94 (1H, d, J=14. 7Hz), 4. 1 6 (1H, d, J=14. 7Hz), 6. 97 (1H, s), 7. 08 (1H, s), 7. 49 (1H, s).

参考例258

3-(4-メチル-4-ペンテニル)-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン(3.4g、15.65ミリモル)を用い、参考例228と同様にして、白色粉末結晶の3-[3-(2-メチル-2-オキシラニル)プロピル]-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン(3.8g、定量的)を得た。

 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

25 1. 33 (3H, s), 1. 56-1. 77 (2H, m), 1. 80-1. 95 (2H, m), 2. 59 (1H, d, J=4. 8Hz), 2. 63 (1H, d, J=4. 8Hz), 3. 85 (2H, t, J=7. 4Hz), 6. 99 (1H, d, J=7. 9Hz), 7. 05-7. 23 (3H, m)。
参考例259

3- [4-(2-メチル-2-オキシラニル) ブチル] -3H-ベンゾオキサゾ ール-2-オンの製造

3-(5-メチル-5-へキセニル)-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン (1.1g、4.8ミリモル)を用い、参考例228と同様にして、無色オイル の3-[4-(2-メチル-2-オキシラニル)ブチル]-3H-ベンゾオキサ ゾール-2-オン (1.2g、定量的)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

- 1. 30 (3H, s), 1. 42-1. 67 (4H, m), 1. 74-1. 88 (2H, m), 2. 57 (1H, d, J=4.9Hz), 2. 60 (1H, d, J=4.9Hz)
- 10 J=4.9Hz), 3.84(2H, t, J=7.2Hz), 6.98(1H, d, J=8.1Hz), 7.02-7.30(3H, m)。 参考例260
 - 3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)オキサゾリジン-2-オンの製造 3-(2-メチル-2-プロペニル)オキサゾリジン-2-オン(4.28g、
- 15 30.35ミリモル)を用い、参考例228の方法により、無色オイルの3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)オキサゾリジン-2-オン(2.87g、収率62%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 36 (3H, s), 2. 66 (1H, d, J=4.5Hz), 2. 70 (1

20 H, d, J=4.5Hz), 3. 15 (1H, d, J=14.7Hz), 3. 5 7-3.75 (3H, m), 4. 25-4. 39 (2H, m).

参考例261

- 3, 3-ジフルオロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1, 3-ジヒドロインドール-2-オンの製造
- 25 3,3-ジフルオロ-1-(2-メチル-2-プロペニル)-1,3-ジヒドロインドール-2-オン(1.08g、4.83ミリモル)を用い、参考例228と同様にして、微黄色粉末の3,3-ジフルオロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1,3-ジヒドロインドール-2-オン(1.14g、収率99%)を得た。

 $^{1}H-NMR$ (CDCl₃) δ ppm:

1. 35 (3H, s), 2. 71 (1H, d, J=4.3Hz), 2. 77 (1H, d, J=4.3Hz), 3. 46 (1H, d, J=15.0Hz), 4. 2 6 (1H, d, J=15.0Hz), 7. 12-7. 24 (2H, m), 7. 4

5 - 7.61(2H, m).

対応する出発原料を用い、参考例261と同様にして、参考例262及び参考 例263の化合物を製造した。

参考例 2 6 2

3, 3-ジメチル-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1, 3-ジ

10 ヒドロインドールー2ーオン

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 31 (3H, s), 1. 39 (6H, s), 2. 67 (1H, d, J=4.5Hz), 2. 74 (1H, d, J=4.5Hz), 3. 53 (1H, d, J=14.0Hz), 4. 22 (1H, d, J=14.0Hz), 7. 00-7. 1

15 0 (2H, m), 7. 16-7. 31 (2H, m).

参考例 2 6 3

1- (2-メチル-2-オキシラニルメチル) -1, 3-ジヒドロインドールー 2-オン

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

20 1. 34 (3H, s), 2. 67 (1H, d, J=4. 5Hz), 2. 76 (1 H, d, J=4. 5Hz), 3. 49-3. 61 (3H, m), 4. 22 (1H, d, J=14. 9Hz), 7. 00-7. 10 (2H, m), 7. 18-7. 3 5 (2H, m),

参考例 2 6 4

25 (2-メチル-2-オキシラニルメチル) カルバミン酸ベンジルエステルの製造 参考例173で製造したN-(2-メチル-2-プロペニル) カルバミン酸ベンジルエステル(3.90g、19.0ミリモル) を塩化メチレン(80ml) に溶解し、m-クロロ過安息香酸(5.15g、20.9ミリモル) を加え、室温終夜で撹拌した。チオ硫酸ナトリウム水溶液及び飽和炭酸水素ナトリウム水溶

液を加え、しばらく撹拌後、分液した。飽和炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濾過した。濾液を減圧濃縮することにより、無色液体の(2-メチル-2-オキシラニルメチル)カルバミン酸ベンジルエステル(4.31g、定量的)を得た。

5 ¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1. 35 (3H, s), 2. 61 (1H, d, J=4.5Hz), 2. 72 (1H, d, J=4.5Hz), 3. 28-3.53 (2H, m), 4. 90 (1H, br), 5. 11 (2H, s), 7. 26-7.44 (5H, m).

対応する出発原料を用い、参考例 2 6 4 と同様にして、参考例 2 6 5 ~参考例 10 2 7 6 の化合物を製造した。

参考例 2 6 5

N-メチル-N-(2-メチル-2-オキシラニルメチル) カルバミン酸ベンジ ルエステル

収率42%

15 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

26 (1. 5H, s), 1. 31 (1. 5H, s), 2. 57 (1H, s),
 61 (1H, s), 2. 99 (3H, s), 3. 24 (1H, d, J=15. 1Hz), 3. 62 (0. 5H, d, J=15. 1Hz), 3. 72 (0. 5H, d, J=15. 1Hz), 5. 14 (2H, s), 7. 27-7. 41 (5H,

20 m).

参考例266

(2-メチル-2-オキシラニルメチル) カルバミン酸4-クロロベンジルエス テル

収率98%

25 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1. 35 (3H, s), 2. 62 (1H, d, J=4.4Hz), 2. 71 (1H, d, J=4.4Hz), 3. 27-3.50 (2H, m), 4. 88 (1H, br), 5. 06 (2H, s), 7. 23-7.41 (4H, m)

参考例 2 6 7

(2-メチル-2-オキシラニルメチル) カルバミン酸4-フルオロベンジルエ ステル

収率100%

 $^{1}H-NMR$ (CDCl₃) δ ppm:

5 1. 34 (3H, s), 2. 61 (1H, d, J=4. 5Hz), 2. 71 (1 H, d, J=4. 5Hz), 3. 32-3. 50 (2H, m), 4. 86 (1H, br), 5. 06 (2H, s), 6. 95-7. 09 (2H, m), 7. 27-7. 41 (2H, m).

参考例 2 6 8

10 (2-メチル-2-オキシラニルメチル) カルバミン酸エチルエステル 収率82%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 24 (3H, t, J=7. 1Hz), 1. 35 (3H, s), 2. 62 (1 H, d, J=4. 5Hz), 2. 74 (1H, d, J=4. 5Hz), 3. 27

15 -3.50 (2H, m), 4.12 (2H, q, J=7.1Hz), 4.78 (1H, br).

参考例 2 6 9

(2-メチル-2-オキシラニルメチル) カルバミン酸4-トリフルオロメトキ シベンジルエステル

20 収率99%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 35 (3H, s), 2. 62 (1H, d, J=4. 4Hz), 2. 71 (1 H, d, J=4. 4Hz), 3. 42 (2H, d, J=5. 6Hz), 4. 90 (1H, br), 5. 10 (2H, s), 7. 20 (2H, d, J=8. 3

25 Hz), 7. 38 (2H, d, J = 8. 3Hz).

参考例270

N-メチル-N-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)カルバミン酸4-フルオロベンジルエステル

収率73%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 25 (1. 5H, s), 1. 30 (1. 5H, s), 2. 56 (1H, s),

2. 61 (1H, s), 2. 97 (3H, s), 3. 22 (1H, d, J=14.

8 Hz), 3. 61 (0. 5H, d, J = 14.8 Hz), 3. 72 (0. 5H,

5 d, J=14.8Hz, 5.10(2H, s), 6.95-7.09(2H, s)

m), 7. 27-7. 41 (2H, m).

参考例271

オキシラニルメチルカルバミン酸4-クロルベンジルエステル

収率97%

 10^{-1} H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

2. 59 (1H, dd, J=2. 6Hz, 4. 6Hz), 2. 79 (1H, t,

J=4.3Hz), 3.11 (1H, br), 3.20-3.32 (1H, m),

3. 50-3. 73 (1H, m), 4. 93 (1H, br), 5. 07 (2H,

s), 7. 23-7. 41 (4H, m).

15 参考例272

オキシラニルメチルカルバミン酸4-フルオロルベンジルエステル

収率89%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

2. 59 (1H, dd, J=2. 6Hz, 4. 6Hz), 2. 79 (1H, t,

20 = 4.3 Hz, 3.11 (1 H, br), 3.21-3.32 (1 H, m),

3. 45-3. 73 (1H, m), 4. 92 (1H, br), 5. 07 (2H,

s), 6. 95-7. 09 (2H, m), 7. 27-7. 41 (2H, m).

参考例273

N-メチル-N-オキシラニルメチルカルバミン酸4-フルオロルベンジルエス

25 テル

収率34%、

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

2. 51 (1H, br), 2. 76 (1H, br), 3. 01 (3H, s), 3.

02-3.27 (2H, m), 3.55-3.91 (1H, m), 5.10 (2

H, s), 6. 95-7. 09 (2H, m), 7. 27-7. 41 (2H, m)。 参考例274

オキシラニルメチルカルバミン酸 t e r t ーブチルエステル 収率83%

- 5 ¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:
 - 1. 45 (9H, s), 2. 59 (1H, dd, J=2.6Hz, 4.6Hz),
 - 2. 78 (1H, t, J=4.4Hz), 3. 09 (1H, br), 3. 16-
 - 3. 28 (1H, m), 3. 38-3. 66 (1H, br), 4. 53-4. 9 1 (1H, br)
- 10 参考例 2 7 5

オキシラニルメチルカルバミン酸ベンジルエステル

収率72%

 1 H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

2. 67 (1H, t, J=4. 5Hz), 2. 91-3. 32 (4H, m), 4.

15 91-5.09 (3H, m), 7.23-7.55 (5H, m).

参考例276

オキシラニルメチルカルバミン酸フェニルエステル

収率90%

 $^{1}H-NMR$ (DMSO-d₆) δ ppm:

20 2. 57 (1H, dd, J=2. 5Hz, 5. 0Hz), 2. 73 (1H, t, J=4. 5Hz), 3. 00-3. 45 (3H, m), 7. 10 (2H, d, J=7. 6Hz), 7. 20 (1H, t, J=7. 6Hz), 7. 38 (2H, t, J=7. 6Hz), 7. 94 (1H, br).

参考例277

25 (4-クロロフェニル) カルバミン酸(2-メチル-2-オキシラニルメチル) エステルの製造

 た。チオ硫酸ナトリウム水溶液を加えて反応混合液を濾過し、炭酸水素ナトリウムと水を加え分液し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮して、微黄色固体の (4-クロロフェニル) カルバミン酸 (2-メチルー2-オキシラニルメチル) エステル (1.1g、定量的) を得た。

- 5 ¹H-NMR (CDCl₃) δ p p m: 1. 42 (3H, s), 2. 71 (1H, d, J=4.6Hz), 2. 82 (1 H, d, J=4.6Hz), 4. 01 (1H, d, J=11.9Hz), 4. 3 7 (1H, d, J=11.9Hz), 6. 79 (1H, br), 7. 23-7. 37 (4H, m) 6.
- 10 参考例278

N-(4-クロロフェニル)-N-メチルカルバミン酸(2-メチル-2-オキシラニルメチル) エステルの製造

20 N-メチルカルバミン酸(2-メチル-2-オキシラニルメチル)エステル(1.7 g、定量的)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 32 (3H, s), 2. 62 (1H, d, J=4.6Hz), 2. 69 (1H, d, J=4.6Hz), 3. 30 (3H, s), 3. 99 (1H, d, J=11.8Hz), 4. 30 (1H, d, J=11.8Hz), 7. 15-7. 2 5 (2H, m), 7. 31-7. 38 (2H, m) \circ

参考例279

25

4-オキシラニルメチルピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステルの製造

ピペラジン-1-カルボン酸 t e r t - ブチルエステル (6.2 g、33.2 9ミリモル)、エピブロモヒドリン (5.4 g、39.42ミリモル)及び炭酸カリウム (5.5 g、39.79ミリモル)のアセトニトリル (70 m 1)中の混合物を3時間加熱還流した。反応液を減圧下にて濃縮し、水を加え、塩化メチレンにより抽出した。飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過し、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル)により精製し、無色オイルの4-オキシラニルメチルピペラジン-1-カルボン酸 t e r t - ブチルエステル (6.2 g、収率77%)を得た。

10 ¹H-NMR (CDCl₃) δ p p m: 1. 46 (9H, s), 2. 21-2. 60 (6H, m), 2. 70-2. 81 (2H, m), 3. 05-3. 12 (1H, m), 3. 35-3. 56 (4H, m),

参考例280

15 [4-(2-メチル-2-オキシラニルメチル) ピペラジン-1-イル] カルバミン酸 t e r t -ブチルエステルの製造

トルエン-4-スルホン酸(2-メチル-2-オキシラニルメチル)エステル (9.75g、40.3ミリモル)及び参考例36で製造したピペラジン-1-イル-カルバミン酸tert-ブチルエステル(6.75g、33.5ミリモ

- 20 ル)をDMF (70ml) に溶解した。この溶液に、トリエチルアミン (7ml、50.3ミリモル) 及びヨウ化カリウム (6.68g、33.5ミリモル) を加え、室温で終夜撹拌した。酢酸エチルで抽出後、有機相を合わせ、水及び飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン/アセトン=
- 25 4/1) により精製し、白色粉末結晶の[4-(2-メチルー2-オキシラニルメチル) ピペラジン-1-イル] カルバミン酸tertーブチルエステル(4.66g、収率51%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 35 (3H, s), 1. 46 (9H, s), 2. 31 (1H, d, J=12)

9Hz), 2. 49-2. 84 (11H, m), 5. 37 (1H, br)。 参考例281

3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-5-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-3H-[1,3,4]オキサジアゾール-2-オンの製造

- 5 参考例49で製造した5-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-3H-[1,3,4] オキサジアゾール-2-オン(3.18g、12.92ミリモル)及びトルエン-4-スルホン酸(2-メチル-2-オキシラニルメチル)エステル(4.80g、19.38ミリモル)のDMF(30m1)溶液に、炭酸カリウム(2.14g、15.50ミリモル)及びヨウ化ナトリウム(2.90
- 10 g、19.38ミリモル)を加え、室温で24時間、更に60℃で4時間攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出し、水で洗浄し、硫酸マグネシムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン/酢酸エチル=9/1)により精製し、白色固体の3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-5-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-3H-[1,3,

15 4] オキサジアゾールー2ーオン(2.37g、収率58%)を得た。

 $^{1}H-NMR$ (DMSO-d₆) δ ppm:

1. 43 (3H, s), 2. 72 (1H, d, J=4. 4Hz), 2. 86 (1 H, d, J=4. 4Hz), 3. 93 (2H, dd, J=14. 8Hz, 22. 2Hz), 7. 28-7. 41 (2H, m), 7. 83-7. 98 (2H, m).

20 5-置換-3H-[1, 3, 4] オキサジアゾール-2-オン及びトルエン-4-スルホン酸(2-メチル-2-オキシラニルメチル) エステルを用い、参考 例281と同様にして、参考例282~参考例289の化合物を製造した。

参考例282

3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-5-フェニル-3H-[1, 3,

25 4] オキサジアゾールー2ーオン

収率41%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 44 (3H, s), 2. 72 (1H, d, J=4. 5Hz), 2. 88 (1H, d, J=4. 5Hz), 3. 87 (1H, d, J=14. 7Hz), 3. 9

9 (1H, d, J=14.7Hz), 7. 40-7.57 (3H, m), 7. 79-7.87 (2H, m).

参考例 2 8 3

3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-5-(4-トリフルオロメチル

5 フェニル) - 3 H- [1, 3, 4] オキサジアゾール-2-オン

収率34%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 45 (3H, s), 2. 73 (1H, d, J=4. 5Hz), 2. 87 (1

H, d, J=4.5Hz), 3. 92 (1H, d, J=14.8Hz), 4. 0

10 0 (1H, d, J = 14.8Hz), 7.75 (2H, d, J = 8.3Hz),

8. 01 (2H, d, J=8.3Hz).

参考例284

3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-5-(4-ビフェニリル)-3 H-[1, 3, 4] オキサジアゾール-2-オン

15 収率38%

 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1. 45 (3H, s), 2. 73 (1H, d, J=4. 5Hz), 2. 89 (1

H, d, J = 4.5 Hz), 3.89 (1H, d, J = 14.8 Hz), 4.0

0 (1H, d, J = 14.8 Hz), 7. 33 - 7.50 (3H, m), 7. 5

20 7-7.75 (4H, m), 7.93 (2H, d, J=8.6Hz).

参考例285

3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-5-(4-クロロフェニル)-3H-[1, 3, 4]オキサジアゾール-2-オン

収率52%

25 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1. 44 (3H, s), 2. 72 (1H, d, J=4. 4Hz), 2. 86 (1 H, d, J=4. 4Hz), 3. 89 (1H, d, J=14. 8Hz), 3. 9 7 (1H, d, J=14. 8Hz), 7. 46 (2H, d, J=8. 7Hz),

7. 80 (2H, d, J = 8.7 Hz).

参考例286

参考例287

3-(2-メチルー2-オキシラニルメチル) -5-(4-フルオロフェニル) -3H-[1,3,4] オキサジアゾールー2-オン 収率72%

- 5 ¹H-NMR (CDCl₃) δ p p m: 1. 43 (3H, s), 2. 72 (1H, d, J=4. 5Hz), 2. 87 (1 H, d, J=4. 5Hz), 3. 88 (1H, d, J=14. 7Hz), 3. 9 6 (1H, d, J=14. 7Hz), 7. 11-7. 21 (2H, m), 7. 7 4-7. 89 (2H, m)
- 3-(2-メチルー2-オキシラニルメチル)-5-[2-(4-クロロフェニル) エチル]-3H-[1,3,4] オキサジアゾールー2-オン収率7.8%

 1 H-NMR (CDC1₃) δ ppm:

- 15 1. 32 (3H, s), 2. 64 (1H, d, J=4. 5Hz), 2. 72 (1 H, d, J=4. 5Hz), 2. 79-2. 90 (2H, m), 2. 93-3. 04 (2H, m), 3. 74 (1H, d, J=14. 8Hz), 3. 79 (1H, d, J=14. 8Hz), 7. 12 (2H, d, J=8. 6Hz), 7. 27 (2H, d, J=8. 6Hz)
- 20 参考例 288

10

3-(2-メチルー2-オキシラニルメチル) -5-[2-(4-クロロフェニル) ビニル] -3H-[1,3,4] オキサジアゾールー<math>2-オン収率100%

 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

- 25 1. 41 (3H, s), 2. 71 (1H, d, J=4. 4Hz), 2. 83 (1H, d, J=4. 4Hz), 3. 88 (2H, s), 6. 60 (1H, d, J=16. 4Hz), 7. 28-7. 47 (5H, m)。 参考例 289
 - 3- (2-メチル-2-オキシラニルメチル) -5- (4-クロロフェノキシメ

チル) - 3H- [1, 3, 4] オキサジアゾール-2-オン 収率59%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 37 (3H, s), 2. 68 (1H, d, J=4. 4Hz), 2. 78 (1 H, d, J=4. 4Hz), 3. 86 (2H, s), 4. 90 (2H, s), 6. 91 (2H, dd, J=2. 3Hz, 6. 9Hz), 7. 29 (2H, dd, J

= 2.3 Hz, 6.9 Hz).

参考例290

2-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1,1-ジオキソ-1,2-ジ

10 ヒドロベンゾ [d] イソチアゾールー3ーオンの製造

サッカリン及びトルエンー4ースルホン酸2ーメチルー2ーオキシラニルメチルエステルから参考例281と同様にして、2ー(2ーメチルー2ーオキシラニルメチル)-1, 1-ジオキソー1, 2-ジヒドロベンゾ [d] イソチアゾールー3-オンを製造した。

15 白色粉末結晶

収率43%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 49 (3H, s), 2. 74 (1H, d, J=4.5Hz), 2. 96 (1H, d, J=4.5Hz), 3. 73 (1H, d, J=15.5Hz), 4. 0

20 4 (1H, d, J=15.5Hz), 7. 81-8.00 (3H, m), 8. 0 9 (1H, dd, J=2.4Hz, 6. 6Hz).

参考例291

25

1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)ピペリジン-4-オンの製造 塩酸4-ピペリドン-水和物を用い、参考例281と同様にして、1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)ピペリジン-4-オンを製造した。

無色オイル、収率50%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 43 (3H, s), 2. 35-2. 51 (5H, m), 2. 58-2. 93 (7H, m).

参考例292

4-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1-(4-トリフルオロメチル ベンジル)ピペラジン-2-オンの製造

1-(4-トリフルオロメチルベンジル)ピペラジン-2-オンを用い、参考5 例281と同様にして、4-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1-(4-トリフルオロメチルベンジル)ピペラジン-2-オンを製造した。

無色粉末晶、収率63%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 37 (3H, s), 2. 34 (1H, d, J=12.9Hz), 2. 5310 2. 67 (4H, m), 2. 77-2. 91 (1H, m), 3. 14-3. 37
(4H, m), 4. 62 (1H, d, J=15. 1Hz), 4. 69 (1H, d, J=15. 1Hz), 7. 38 (2H, d, J=8. 2Hz), 7. 60 (2H, d, J=8. 2Hz),

参考例293

15 4-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1-(tert-ブチル) ピペラジン-2-オンの製造

1-(tert-ブチル)ピペラジン-2-オンを用い、参考例281と同様にして、4-(2-メチル-2-オキシラニルメチル) <math>-1-(tert-ブチル)ピペラジン-2-オンを製造した。

20 無色粉末晶、収率39%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 38 (3H, s), 1. 45 (9H, s), 2. 31 (1H, d, J=12.9Hz), 2. 42-2.55 (4H, m), 2. 74-2.88 (1H, m), 3. 02 (1H, d, J=16.1Hz), 3. 20 (1H, d, J=16.1

25 Hz), 3. 28-3. 37(2H, m).

参考例294

- (S) -1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル) -4-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジンの製造
 - (R) -トルエン-4-スルホン酸(2-メチル-2-オキシラニルメチル)

エステル (0.80g、3.30ミリモル) 及び1-(4-トルフルオロメトキシフェニル) ピペラジン (0.91g、3.36ミリモル) のDMF (8m1) 溶液に、トリエチルアミン (0.55m1、3.96ミリモル) を加え、更に 2 と時間室温で攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出し、水で洗浄し、

5 硫酸マグネシムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=100/1)により精製し、微黄色液体の(S)-1-(2-メチルー2-オキシラニルメチル)-4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペラジン(0.46g、収率44%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

- 10 1.40(3H, s), 2.34(1H, d, J=12.9Hz), 2.52-2.77(7H, m), 3.10-3.27(4H, m), 6.81-6.94(2H, m), 7.06-7.17(2H, m)。 参考例295
- (S) -1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル) ピペリジン-4-カルボ 15 ン酸エチルエステルの製造
 - (R) -トルエン-4-スルホン酸(2-メチル-2-オキシラニルメチル) エステル(13.5g、55.8ミリモル)、ピペリジン4-カルボン酸エチル エステル(8.9g、50.9ミリモル)及びトリエチルアミン(6.5g、64.4ミリモル)の混合物をDMF(70ml)中にて室温で2日間撹拌した。
- 20 反応液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機相を水、飽和食塩水で洗浄し、 硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残 渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(nーヘキサン/酢酸エチル=3/ 1)により精製し、無色油状物質の(S)-1-(2-メチル-2-オキシラニ ルメチル)ピペリジン-4-カルボン酸エチルエステル(5:4g、収率47

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

%)を得た。

25

1. 25 (3H, t, J=7. 1Hz), 1. 36 (3H, s), 1. 67-1. 93 (4H, m), 1. 97-2. 08 (2H, m), 2. 19-2. 37 (2 H, m), 2. 48 (1H, d, J=11. 5Hz), 2. 58 (2H, s), 2. 78-2. 97 (2H, m), 4. 13 (2H, q, J=7. 1Hz)。 対応する出発原料を用い、参考例295と同様にして、参考例296~参考例299の化合物を製造した。

参考例296

5 (S) -1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)ピペリジン-4-カルボン酸4-トリフルオロメチルベンジルエステル

無色油状物、収率18%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 35 (3H, s), 1. 69-2. 10 (6H, m), 2. 25-2. 37

10 (1H, m), 2. 28 (1H, d, J=12. 9Hz), 2. 48 (1H, d, J=12. 9Hz), 2. 58 (2H, s), 2. 81-3. 00 (2H, m), 5. 11 (2H, s), 7. 20 (2H, d, J=8. 0Hz), 7. 38 (2H, d, J=8. 0Hz).

参考例297

15 (S) -1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)ピペリジン-4-カルボン酸4-クロルベンジルエステル

無色油状物、収率26%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 36 (3H, s), 1. 75-2. 16 (7H, m), 2. 27 (1H, d), J=12. 9Hz), 2. 50 (1H, d), J=12. 9Hz), 2. 58 (2H, s), 2. 87-3. 09 (2H, m), 5. 13 (2H, s), 7. 17

-7.21 (2H, m), 7.27-7.31 (2H, m).

参考例298

20

(S) -1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)ピペリジン-4-カルボ

25 ン酸 (4-クロルベンジル) アミド

無色油狀物、収率26%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 36 (3H, s), 1. 75-2. 16 (7H, m), 2. 27 (1H, d, J=12. 9Hz), 2. 50 (1H, d, J=12. 9Hz), 2. 58 (2

H, s), 2. 87-3. 09 (2H, m), 4. 41 (2H, d, J=5. 8 Hz), 5. 78 (1H, br), 7. 17-7. 21 (2H, m), 7. 27 -7. 31 (2H, m).

参考例299

5 (S) -1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)ピペリジン-4-カルボン酸(4-クロロフェニル)アミド

無色油状物、収率33%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 37 (3H, s), 1. 82-2. 08 (6H, m), 2. 13-2. 27

10 (1H, m), 2. 30 (1H, d, J=13. 0Hz), 2. 53 (1H, d, J=13. 0Hz), 2. 60 (2H, s), 2. 93-3. 12 (2H, m),

7. 16 (1H, bs), 7. 26-7. 31 (2H, m), 7. 45-7. 4

9 (2H, m),

参考例300

15 5-(2-メチル-2-オキシラニルメチルスルファニル)-1-フェニル-1H-テトラゾールの製造

1-フェニル-5-メルカプト-1H-テトラゾール(3.5g、19.64 ミリモル)、トルエンー4-スルホン酸(2-メチル-2-オキシラニルメチル)エステル(5g、20.64ミリモル)、炭酸カリウム(3g、21.71

- 20 ミリモル)、ヨウ化ナトリウム(4.5g、30.02ミリモル)及びDMF (30ml)の混合物を60℃にて6時間撹拌した。反応液を室温に戻し、水を 加え、酢酸エチルにより2回抽出した。有機相を合わせ、5%苛性ソーダにより 洗浄後、3回水洗し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧下に て濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸
- 25 エチル= 2/1)により精製し、無色オイルの5-(2-メチル-2-オキシラ ニルメチルスルファニル)<math>-1-フェニル-1Hーテトラゾール(1.9g、収率39%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 46 (3H, s), 2. 73 (1H, d, J=4. 5Hz), 2. 91 (1

H, d, J=4.5Hz), 3.61 (1H, d, J=13.9Hz), 3.7 (1H, d, J=13.9Hz), 7.50-7.65 (5H, m)。 参考例301

3-(2-メチルー2-オキシラニル) プロピオン酸 t e r t - ブチルエステル 5 の製造

水素化ナトリウム (3.71g、92.82ミリモル)のDMSO (50ml) 懸濁液に氷冷攪拌下、トリメチルスルホキソニウムヨージド (19.54g、88.78ミリモル)を加え、2.5時間攪拌し、4ーオキソーペンタン酸tertーブチルエステル (13.90g、80.71ミリモル)のDMSO

10 (20ml) 溶液を加え、室温で15時間攪拌した。氷水に注ぎ、ジエチルエー テルで抽出し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。微黄色 液体の3-(2-メチル-2-オキシラニル) プロピオン酸 tert-ブチルエ ステル(10.1g、収率67%) を得た。

 $^{1}H-NMR$ (CDCl₃) δ ppm:

15 1. 32 (3H, s), 1. 44 (9H, s), 1. 85-1. 94 (2H, m), 2. 27-2. 33 (2H, m), 2. 58 (1H, d, J=4. 7 Hz), 2. 63 (1H, d, J=4. 7Hz).

参考例302

2-イソプロピルー2-メトキシメトキシメチルオキシランの製造

20 2ーメトキシメトキシメチルー3ーメチルー1ーブテン(89g、615ミリモル)の塩化メチレン(800m1)溶液にmークロロ過安息香酸(213g、861ミリモル)を氷冷攪拌下少量ずつ加え、室温下18時間攪拌後、10%亜硫酸カリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧濃縮し、無色液体の2ーイソプロピルー2ーメトキシメトキシメチル25 オキシラン(98g、定量的)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

0. 95 (3H, d, J=7. 0Hz), 1. 02 (3H, d, J=7. 0 Hz), 1. 84-2. 05 (1H, m), 2. 66 (1H, d, J=4. 9 Hz), 2. 75 (1H, d, J=4. 9Hz), 3. 37 (3H, s), 3. 63 (1H, d, J=11. 3Hz), 3. 70 (1H, d, J=11. 3Hz), 4. 62 (2H, s).

参考例303

2-エチル-2-メトキシメトキシメチルオキシランの製造

5 参考例206で製造した2ーメトキシメトキシメチルー1ーブテン(98g、757ミリモル)の塩化メチレン(800ml)溶液にmークロロ過安息香酸(143.7g、833ミリモル)を氷冷攪拌下少量ずつ加え、室温下終夜攪拌後、水、10%亜硫酸ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧濃縮し、無色液体の2ーエチルー2ーメトキシメ10 トキシメチルオキシラン(111g、定量的)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δ p p m:

0. 96 (3H, t, J=7.5Hz), 1. 60-1. 73 (1H, m), 1. 77-1. 93 (1H, m), 2. 66 (1H, d, J=4.8Hz), 2. 7 4 (1H, d, J=4.8Hz), 3. 37 (3H, s), 3. 56 (1H, d, J=11.2Hz), 3. 65 (1H, d, J=11.2Hz), 4. 64 (2

参考例304

H, s).

15

2-(2-メトキシメトキシエチル) オキシランの製造

4-メトキシメトキシー1-ブテン(10.46g、90.1ミリモル)の塩 20 化メチレン(250ml)溶液にm-クロロ過安息香酸(20.6g、95.6 ミリモル)を氷冷攪拌下少量ずつ加え、室温下6時間攪拌後、反応液を濾過して 濾液を10%亜硫酸ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄し、硫 酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、無色液体の2-(2-メトキシメトキシ エチル)オキシラン(10.3g、86%)を得た。

25 ¹H-NMR (CDCl₃) δ p p m :
 1. 69-1. 96 (2H, m), 2. 53 (1H, dd, J=2. 7Hz, 4.
 9Hz), 2. 79 (1H, t, J=4. 9Hz), 3. 02-3. 08 (1H, m), 3. 38 (3H, s), 3. 68 (2H, t, J=5. 9Hz), 4. 6
 4 (2H, s)。

参考例305

4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-カルボニルクロリドの製造

4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン(0.6g、2.45 ミリモル)のトルエン(6ml)懸濁液にトリホスゲン(0.25g、0.86 ミリモル)及びピリジン(0.4ml、4.90ミリモル)を加え、2.5時間加熱還流した。酢酸エチルを加え、10%塩酸で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、微黄色液体の4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-カルボニルクロリド(0.72g、収率96%)を得た。

10 ¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 79-2. 10 (4H, m), 3. 50-3. 96 (4H, m), 4. 58 -4. 75 (1H, m), 6. 97 (2H, d, J=8. 8Hz), 7. 56 (2H, d, J=8. 8Hz).

参考例306

15 4-(4-トリフルオロメチルフェニルアミノ)ピペリジン-1-カルボニルクロリドの製造

(4-トリフルオロメチルフェニルアミノ)ピペリジン(1. 14g、4. 6 7ミリモル)の塩化メチレン(10ml)溶液にトリホスゲン(0. 55g、1. 8 7ミリモル)及びトリエチルアミン(0. 98ml、7. 01ミリモル)を加

20 え、室温で1.5時間攪拌した。反応液を水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、微黄色液体の4-(4-トリフルオロメチルフェニルアミノ)ピペリジン-1-カルボニルクロリド(1.43g、定量的)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 33-1. 65(2H, m), 2. 09-2. 24(2H, m), 3. 02

25 -3.22(1 H, m), 3. 22-3.41(1 H, m), 3. 48-3.70 (1 H, m), 4. 20-4.35(2 H, m), 6. 66(2 H, d, J= 8.5 Hz), 7. 43(2 H, d, J= 8.5 Hz).

参考例305又は参考例306に示すように、トリホスゲン及びトリエチルア ミン又はピリジン存在下、アミン類、環状アミン類、ベンゼン縮合へテロ環化合 物を反応させることにより、参考例307~参考例324の化合物を製造した。 参考例307

5-クロロ-2, 3-ジヒドロインドール-1-カルボニルクロリド 微黄色固体、収率100%

5 ¹H-NMR (CDCl₃) δppm: 3. 19 (2H, t, J=8. 3Hz), 4. 28 (2H, t, J=8. 3 Hz), 7. 18-7. 22 (2H, m), 7. 80 (1H, d, J=9. 5 Hz),

参考例308

10 6 - クロロ-3, 4 - ジヒドロ-1 H - イソキノリン-2 - カルボニルクロリド 微黄色液体、収率100%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

2. 83-3. 00 (2H, m), 3. 83 (1H, t, J=6.0Hz), 3. 90 (1H, t, J=6.0Hz), 4. 71 (1H, s), 4. 80 (1H, t)

15 s), 7.06 (1H, d, $J = 8.0 \,\mathrm{Hz}$), 7.13-7.28 (2H, m).

参考例309

6-クロロ-3, 4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-カルボニルクロリド 黄色液体、収率100%

 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm: 1. 99-2. 09 (2H, m), 2. 79 (2H, t, J=6. 5Hz), 3. 94 (2H, t, J=6. 3Hz), 7. 14-7. 20 (2H, m), 7. 6 2 (1H, d, J=8. 5Hz).

参考例310

25 5-クロロ-1, 3-ジヒドロイソインドール-2-カルボニルクロリド 黄色液体、収率100%、

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

3. 19 (2H, t, J=8. 3Hz), 4. 28 (2H, t, J=8. 3 Hz), 7. 18-7. 22 (2H, m), 7. 80 (1H, d, J=9. 5

Hz)。

参考例311

4-クロロカルボニルピペラジン-1-カルボン酸 t e r t ーブチルエステル 微黄色固体、収率100%

5 ¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1. 47 (9H, s), 3. 16-3. 29 (2H, m), 3. 37-3. 55 (4H, m), 3. 55-3. 78 (2H, m).

参考例312

4- (4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル) ピペラジン-1-

10 カルボニルクロリド

収率100%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

3. 43-3. 80 (8H, m), 5. 15 (2H, s), 7. 15-7. 25 (2H, m), 7. 33-7. 45 (2H, m).

15 参考例313

4- [3- (4-トリフルオロメチルフェニル) -2-プロペニルオキシカルボニル] ピペラジン-1-カルボニルクロリド

収率100%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

- 20 3. 54-3. 65 (4H, m), 3. 65-3. 72 (2H, m), 3. 72
 -3. 83 (2H, m), 4. 80 (2H, dd, J=1. 1Hz, 6. 1
 Hz), 6. 39 (1H, dt, J=6. 1Hz, 15. 9Hz), 6. 68
 (1H, d, J=15. 9Hz), 7. 49 (2H, d, J=8. 4Hz), 7.
 59 (2H, d, J=8. 4Hz)。
- 25 参考例314

4-(4-クロロベンジル)ピペラジン-1-カルボニルクロリド

茶色液体、収率100%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

2. 65-2. 96 (4H, m), 3. 67-4. 08 (6H, m), 7. 36

-7.39(4H, m).

参考例315

4- (4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン-1-カルボニルクロリド 茶色液体、収率100%

5 ¹H-NMR (CDC1₃) δ p p m: 2. 97-3. 12 (4H, m), 3. 91-4. 06 (2H, m), 4. 06 -4. 21 (2H, m), 4. 15 (2H, s), 7. 58-7. 73 (4H,

m)。

参考例 3 1 6

10 4- (4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペラジン-1-カルボニルクロリド

茶色液体、収率100%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

2. 58-2. 85 (4H, m), 3. 58-3. 90 (6H, m), 7. 17

15 -7.25(2H, m), 7.35-7.46(2H, m).

参考例317

4-(4-)リンルオロメトキシフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-カルボニルクロリド

微茶色液体、収率57%

20 ${}^{1}H-NMR$ (CDCl₃) δ ppm:

2. 54-2. 67 (2H, m), 3. 85 (1H, t, J=5. 7Hz), 3. 94 (1H, t, J=5. 7Hz), 4. 28 (1H, d, J=2. 7Hz), 4. 36 (1H, d, J=2. 7Hz), 5. 94-6. 06 (1H, m), 7. 16-7. 21 (2H, m), 7. 36-7. 41 (2H, m).

25 参考例318

4-(4-メトキシフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-カルボニルクロリド

微茶色液体、収率60%

 $^{1}H-NMR$ (CDCl₃) δ ppm:

2. 54-2. 67 (2H, m), 3. 51 (1H, t, J=5. 6Hz), 3. 81 (3H, s), 3. 92-4. 02 (1H, m), 4. 23-4. 31 (1 H, m), 4. 31-4. 37 (1H, m), 5. 87-5. 96 (1H, m), 6. 85-6. 90 (2H, m), 7. 29-7. 35 (2H, m).

5 参考例319

4-(3-1) (3-1)

微茶色液体、収率100%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

10 2. 58-2. 71 (2H, m), 3. 87 (1H, t, J=5. 7Hz), 3. 96 (1H, t, J=5. 7Hz), 4. 31 (1H, d, J=2. 8Hz), 4. 39 (1H, d, J=2. 8Hz), 6. 04-6. 15 (1H, m), 7. 45-7. 63 (4H, m).

参考例320

15 4- (4-ブロモフェニル) -1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-カ ルボニルクロリド

微茶色液体、収率100%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

2. 52-2.67 (2H, m), 3. 84 (1H, t, J=5.7Hz), 3.

20 93 (1H, t, J=5.7Hz), 4.27 (1H, d, J=2.6Hz), 4.35 (1H, d, J=2.6Hz), 5.94-6.06 (1H, m), 7. 21-7.24 (2H, m), 7.43-7.49 (2H, m)。

参考例321

4- (4-フルオロフェニル) -1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-

25 カルボニルクロリド

微茶色液体、収率100%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

2. 54-2. 67 (2H, m), 3. 84 (1H, t, J=5. 7Hz), 3. 93 (1H, t, J=5. 7Hz), 4. 27 (1H, d, J=2. 6Hz),

4. 35 (1H, d, J=2.6Hz), 5. 90-6. 00 (1H, m), 7. 00-7. 07 (2H, m), 7. 24-7. 35 (2H, m)。 参考例322

N- (4-クロロフェニル) -N-シクロヘキシルカルバミルクロリド

5 微黄色固体、収率100%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

0. 79-1. 06 (1H, m), 1. 14 (2H, t, J=3, 5Hz, 12. 5Hz), 1. 23-1. 44 (2H, m), 1. 50-65 (1H, m), 1.

67-1.81 (2H, m), 1.87-2.00 (2H, m), 4.78 (1

10 H, m), 7.06-7.10(2H, m), 7.36-7.41(2H, m)。 参考例323

N-メチル-N-(4-トリフルオロメトキシベンジル) カルバミルクロリド 黄色液体、収率100%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

15 3. 09 (3H, s), 4. 58 (2H, s), 7. 16-7. 33 (4H, m).

参考例324

4-[(4-トリフルオロメチルベンジリデン)アミノ]ピペラジン-1-カルボニルクロリド

20 茶色液体、収率100%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

3. 17-3. 39 (4H, m), 3. 74-4. 02 (4H, m), 7. 56 (1H, s), 7. 60 (2H, d, J=8. 3Hz), 7. 69 (2H, d, J=8. 3Hz).

25 参考例 3 2 5

4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペラジン-1-カルボニルクロリドの製造

1-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペラジン(1.0g、4.1ミリモル)のトルエン(20ml)懸濁液に氷冷攪拌下、トリホスゲン(0.42

g、1.4ミリモル)及びピリジン(0.66m1、8.2ミリモル)を加え、100で4.5時間攪拌した。酢酸エチルを加え、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、茶色液体の4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペラジン-1-カルボニルクロリド(1.3g、定量的)を得た。

 $5^{1}H-NMR$ (CDCl₃) δ ppm:

3. 08-3. 30 (4H, m), 3. 67-4. 00 (4H, m), 6. 79
-6. 98 (2H, m), 7. 08-7. 17 (2H, m).

対応する出発原料を用い、参考例325と同様にして、参考例326~参考例332の化合物を定量的に製造した。

10 参考例326

4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジン-1-カルボニルクロリド 1 H-NMR(CDC 1 $_3$) δ p p m :

3. 26-3. 39(4H, m), 3. 76-3. 87(2H, m), 3. 87-3. 98(2H, m), 6. 87-6. 98(2H, m), 7. 48-7. 5

15 9 (2H, m).

参考例327

4-(4-メトキシフェニル)ピペラジン-1-カルボニルクロリド

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

3. 04-3. 15 (4H, m), 3. 52-3. 75 (2H, m), 3. 75

20 -3.92 (2H, m), 3.78 (3H, s), 6.81-6.98 (4H, m).

参考例328

4-(4-クロロフェニル)ピペラジン-1-カルボニルクロリド

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

25 3. 10-3. 25 (4H, m), 3. 37-3. 52 (2H, m), 3. 73
-3. 90 (2H, m), 6. 83-6. 88 (2H, m), 7. 20-7. 2
5 (2H, m)。

参考例329

4-(3-クロロフェニル)ピペラジン-1-カルボニルクロリド

 $^{1}H-NMR$ (CDCl₃) δ ppm:

3. 15-3. 29 (4H, m), 3. 73-3. 94 (4H, m), 6. 77 -6. 81 (1H, m), 6. 88-6. 91 (2H, m), 7. 20 (1H, t, J=8. 3Hz).

5 参考例330

4-(3,4-i)クロロフェニル)ピペラジン-1-iカルボニルクロリド 1 H-NMR(CDC 1_3) δ ppm:

3. 0.8-3. 2.7 (4H, m), 3. 3.7-3. 4.8 (2H, m), 3. 6.0 -3. 7.3 (1H, m), 3. 7.3-3. 9.0 (1H, m), 6. 7.5 (1H,

10 dd, J=2.9Hz, 9.0Hz), 6.96-6.98 (1H, m), 7. 30 (1H, dd, J=5.1Hz, 9.0Hz).

参考例331

4-(4-フルオロフェニル)ピペラジン-1-カルボニルクロリド

 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

15 3. 04-3. 19 (4H, m), 3. 40-3. 50 (2H, m), 3. 62
-3. 75 (1H, m), 3. 75-3. 92 (1H, m), 6. 86-7. 0
3 (4H, m).

参考例332

4-(3-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジン-1-カルボニルクロリド

 20^{-1} H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

3. 21-3. 35 (4H, m), 3. 42-3. 54 (2H, m), 3. 77
-3. 96 (2H, m), 7. 02-7. 19 (3H, m), 7. 31-7. 4
6 (1H, m),

参考例333

25 4-[1-(4-)リフルオロメトキシフェニル)ピペリジン-4-イル] ピペ ラジン-1-カルボン酸 t e r t - ブチルエステルの製造

4-ピペリジン-4-イルピペラジン-1-カルボン酸 t e r t -ブチルエス テル (1.5 g、5.67ミリモル)、4- (トリフルオロメトキシ)ブロムベンゼン (3.36 g、13.92ミリモル)、酢酸パラジウム (25 mg、0.

11ミリモル)、BINAP(87mg、0.14ミリモル)、tertーブトキシナトリウム(1.07g、11.14mmol)、およびトルエン(20ml)の混合物を窒素雰囲気下、80℃にて8時間攪拌した。反応液を室温に戻し、酢酸エチル10ml、飽和食塩水20mlを加え、濾過した。濾液を分液し、5 有機相を硫酸ナトリウムにより乾燥した。濾過後、濾液を濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=20/1)により精製することにより黄色粉末の4-[1-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペリジン-4-イル]ピペラジン-1-カルボン酸tertーブチルエステル(1.01g、42%)を得た。

10 ¹H-NMR (CDCl₃) δ p p m:
1. 49 (9H, s), 1. 52-1. 75 (2H, m), 1. 83-1. 99
(2H, m), 2. 31-2. 52 (5H, m), 2. 64-2. 81 (2H, m), 3. 36-3. 49 (4H, m), 3. 62-3. 75 (2H, m), 6. 86 (2H, d, J=8. 5Hz), 7. 09 (2H, d, J=8. 5Hz).

15 参考例334

25

た。

1-[1-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペリジン-4-イル] ピペラジンの製造

4-[1-(4-)リフルオロメトキシフェニル)ピペリジン-4-イル]ピペラジン-1-カルボン酸 t e r t - ブチルエステル(1 g、2. 3 3 5 1 5

20 ル)を塩化メチレン(10ml)に溶解し、氷冷下にてトリフルオロ酢酸(10ml)を加え、室温下にて1時間攪拌した。反応液を25%苛性ソーダ(40ml)、飽和食塩水(10ml)の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。 濾過後、濾液を濃縮し、黄色アモルファスの1-[1-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペリジン-4-イル]ピペラジン(770mg、定量的)を得

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 52-1. 75 (2H, m), 1. 83-1. 99 (2H, m), 2. 25 -2. 38 (1H, m), 2. 48-2. 76 (6H, m), 2. 79-2. 9 9 (4H, m), 3. 56-3. 75 (2H, m), 6. 89 (2H, d, J=

8.5Hz), 7.09 (2H, d, J=8.5Hz). 参考例334と同様の方法により、以下の化合物を製造した。

表1

$$HN$$
 N
 N
 R

5

参考例	X	R	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ ppm	
335	none	OCF ₃	1. 52-1. 75 (2H, m), 1. 83-1. 99 (2H, m), 2. 25-2. 38 (1H, m), 2. 48-2. 76 (6H, m), 2. 79-2. 99 (4H, m), 3. 56-3. 75 (2H, m), 6. 89 (2H, d, J=8. 5Hz), 7. 09 (2H, d, J=8. 5Hz)	
336	C=0	C1	1.31-1.55(2H, m), 1.69-1.98(2H, m), 2.36-2.60(5H, m), 2.69-3.00(6H, m), 3.69-3.86(1H, m), 4.55-4.79(1H, m), 7.24-7.43(4H, m)	
337	C=0	OCF ₃	1.31-1.60(2H, m), 1.71-2.00(2H, m), 2.38-2.6 0(5H, m), 2.67-3.07(6H, m), 3.62-3.86(1H, m), 4.57-4.83(1H, m), 7.25(2H, d, J=2.3Hz, 8.7Hz), 7.45(2H, d, J=2.3Hz, 8.7Hz).	
338	CH ₂	Cl	1. 45-1. 60 (2H, m), 1. 67-1. 83 (2H, m), 1. 86-2. 00 (2H, m), 2. 12-2. 24 (1H, m), 2. 45-2. 57 (4H, m), 2. 79-2. 93 (6H, m), 3. 44 (2H, s), 7. 14-7. 31 (4H, m)	
339	CH ₂	OCF ₃	1. 48-1. 81 (4H, m), 1. 85-2. 00 (2H, m), 2. 12-2. 2 9 (1H, m), 2. 43-2. 57 (4H, m), 2. 76-2. 98 (6H, m), 3. 46 (2H, s), 7. 15 (2H, d, J=8. 5Hz), 7. 33 (2H, d, J=8. 5Hz)	

表 2

$$HN \longrightarrow N \longrightarrow N$$

参考例	X	R	¹H-NMR (CDCl ₃) δ ppm	
340	C=0	C1	1. 29-1. 48 (2H, m), 1. 67-1. 86 (2H, m), 2. 31- 2. 69 (7H, m), 3. 07-3. 21 (2H, m), 3. 31-3. 50 (2H, m), 3. 60-3. 83 (2H, m), 7. 26-7. 45 (4H, m)	
341	C=0	OCF ₃	1.31-1.50(2H, m), 1.64-1.83(2H, m), 2.29- 2.69(7H, m), 3.07-3.21(2H, m), 3.31- 3.50(2H, m), 3.64-3.83(2H, m), 7.25(2H, d, J=8.7Hz), 7.45(2H, d, J=8.7Hz)	
342	CH ₂	OCF ₃	1. 25-1. 48 (2H, m), 1. 69-1. 86 (2H, m), 2. 19- 2. 62 (11H, m), 3. 00-3. 17 (2H, m), 3. 50 (2H, s), 7. 15 (2H, d, J=8. 6Hz), 7. 34 (2H, d, J=8. 6Hz)	
343	CH ₂	C1	1.24-1.43(2H, m), 1.74-1.86(2H, m), 2.21- 2.60(11H, m), 3.02-3.17(2H, m), 3.46(2H, s), 7.19-7.33(4H, m)	
344	none	OCF ₃	1.31-1.51 (2H, m), 1.76-1.93 (2H, m), 2.29-2.45 (1H, m), 2.52-2.79 (6H, m), 3.10-3.26 (6H, m), 6.88 (2H, d, J=8.6Hz), 7.10 (2H, d, J=8.6Hz).	
345	none	C1	1.33-1.52(2H, m), 1.81-1.98(2H, m), 2.26- 2.43(1H, m), 2.52-2.74(6H, m), 3.05- 3.21(6H, m), 6.84(2H, d, J=6.9Hz), 7.19 (2H, d, J=6.9Hz)	

表 3

参考例	R	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ ppm
346	4-C1Ph-	2.98-3.12(8H, m), 6.80-6.94(6H, m), 7.24(2H, d, J=2.3Hz, 6.8Hz)
347	4-CF ₃ PhCH ₂ -	3.04(8H, s), 5.08(2H, s), 6.90(4H, s), 7.54(2H, d, J=8.2Hz), 7.63(2H, d, J=8.2Hz)
348	4-C1PhCH ₂ -	3.03(8H, s), 4.98(2H, s), 6.89(4H, s), 7.35(4H, s).
349	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	3.04(8H, s), 5.01(2H, s), 6.90(4H, s), 7.22(2H, d, J=8.5Hz), 7.45(2H, d, J=8.5Hz)
350	4-CF ₃ OPh-	2.96-3.14(8H, m), 6.82-6.98(6H, m), 7.06-7.16(2H, m)
351	4-CF ₃ Ph-	2.96-3.14(8H, m), 6.84-7.00(6H, m), 7.53(2H, d, J=8.6Hz)

5 表 4

$$\begin{array}{c|c} H & & \\ N & & \\ \end{array}$$

参考 例	R	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ ppm
352	C1-	2.96-3.16(8H, m), 3.97(1H, br), 4.20(1H, d, J=5.4Hz), 6.55(1H, d, J=8.8Hz), 6.60(1H, d, J=8.8Hz), 6.90(1H, d, J=8.8Hz), 7.00-7.14(4H, m), 7.18-7.25(1H, m)
353	CF ₃ O-	2.94-3.20(8H, m), 4.00(1H, br), 4.21(1H, d, J=5.3Hz), 6.57(1H, d, J=6.8Hz), 6.64(1H, d, J=8.8Hz), 6.80-7.12(5H, m), 7.16-7.25(1H, m)

表 5

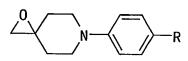
参考例	R	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ ppm
354		1.51-1.73(2H, m), 1.76-1.92(2H, m), 2.51 -2.82(3H, m), 3.10-3.27(2H, m), 6.92-7.08(4H, m), 7.12-7.27(2H, m), 7.56(2H, d, J=8.6Hz)
355	_N	1. 33-1.60(4H, m), 1.69-2.02(4H, m), 2.29-2.64(5H, m), 2.76-2.88(2H, m), 3.05-3.17(2H, m), 4.14-4.31(1H, m), 6.85(2H, d, J=8.7Hz), 7.12(2H, d, J=8.7Hz)
356	N — OCF ₃	1.52-1.98(4H, m), 2.26-2.43(1H, m), 2.55-2.74(2H, m), 3.10-3.26(2H, m), 7.18(2H, d, J=8.4Hz), 7.55(2H, d, J=8.4Hz)
357	N N OCF3	1.60-1.81(4H, m), 2.57-2.74(3H, m), 3.05-3.21(6H, m), 3.60-3.83(4H, m), 6.90(2H, d, J=8.4Hz), 7.13(2H, d, J=8.4Hz)
358		1.56-1.73(2H, m), 1.83-1.89(3H, m), 2.57-2.82(3H, m), 3.18-3.24(2H, m), 6.95-7.05(4H, m), 7.20-7.25(2H, m), 7.53-7.57(2H, m)
359		1.57-1.86(4H, m), 2.52-2.81(4H, m), 3.19-3.25(2H, m), 5.03(2H, s), 6.89- 6.94(2H, m), 7.11-7.25(4H, m), 7.44- 7.48(2H, m)
360		1.51-1.68(3H, m), 1.78-1.84(2H, m), 2.50-2.64(1H, m), 2.67-2.79(2H, m), 3.15-3.21(2H, m), 5.11(1H, s), 6.87- 6.94(2H, m), 7.12-7.18(2H, m), 7.52- 7.57(2H, m), 7.62-7.66(2H, m)
361	-C1	1.60-2.12(5H, m), 2.52-2.66(1H, m), 2.71-2.83(2H, m), 3.22-3.28(2H, m), 5.01(2H, s), 6.88-6.93(2H, m), 7.11- 7.18(2H, m), 7.30-7.41(4H, m)
362		1.86-2.18(3H, m), 2.35-2.52(1H, m), 2.61-2.69(1H, m), 2.93-3.01(5H, m), 3.24-3.59(3H, m), 4.49(2H, s), 6.67- 6.70(2H, m), 7.07-7.17(4H, m), 7.23- 7.27(2H, m)

表 6

参考例	R1	R2	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ ppm
363	N CH ₃ CH ₃ CH ₃	CH ₃	1.50(9H, s), 2.44(3H, s), 3.00- 3.14(4H, ,m), 3.49-3.57(4H, m), 3.72(2H, s), 6.89(2H, d, J=7.2 Hz), 7.26(2H, d, J=7.2 Hz).
364	N O CH ₃ CH ₃ CH ₃	C ₂ H ₅	1.15(3H, t, J=7.1Hz), 1.48(9H, s), 2.18(1H, brs), 2.69(2H, q, J=7.1Hz), 3.09-3.12(4H, m), 3.55- 3.59(4H, m), 3.73(2H, s), 6.86- 6.92(2H, m), 7.23-7.26(2H, m).
365	-N CI	CH ₃	1.09-1.16(3H, m), 1.78-1.88(2H, m), 2.49(3H, s), 2.73-2.80(2H, m), 3.17-3.31(3H, m), 3.62-3.79(5H, m), 3.92(2H, s), 6.67-6.70(2H, m), 6.91-6.93(2H, m), 7.13-7.19(2H, m), 7.39-7.42(2H, m).

参考例222と同様の方法により、以下の化合物を製造した。

表 7



参考例	R	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ ppm
366	-C1	1.51-1.67(2H, m), 1.90-2.04(2H, m), 2.72(2H, s), 3.18-3.43(4H, m), 6.89(2H, d, J=8.4Hz), 7.21(2H, d, J=8.4Hz)
367	-OCF ₃	1.53-1.67(2H, m), 1.86-2.04(2H, m), 2.73(2H, s), 3.22-3.45(4H, m), 6.93(2H, d, J=8.4Hz), 7.11(2H, d, J=8.4Hz).
368	CH ₃ OCF ₃	1.53-1.63(2H, m), 1.90-2.06(2H, m), 2.73(2H, s), 3.24(3H, s), 3.27- 3.45(4H, m), 6.72(2H, d, J=8.4Hz), 6.90-7.10(6H, m).
369		1.54-1.69(2H, m), 1.92-2.06(2H, m), 2.73(2H, s), 3.20-3.43(4H, m), 6.84- 6.96(6H, m), 7.14(2H, d, J=8.4Hz)
370	-N 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0	1.58-1.69(2H, m), 1.88-2.15(6H, m), 2.71(2H, s), 2.90-3.04(2H, m), 3.17- 3.44(6H, m), 4.31-4.46(1H, m), 6.85- 6.94(6H, m), 7.14(2H, d, J=8.4Hz)
371	_NNOCF_3	1.55-1.71(2H, m), 1.92-2.04(2H, m), 2.72(2H, s), 3.12-3.35(12H, m), 6.86-7.00(6H, m), 7.14(2H, d, J=8.5Hz).

5 参考例186と同様の方法により、以下の化合物を製造した。

参考例372

1- (4-ヒドロキシフェニル) -4-フェニルピペリジン-4-オール

Ms; 269 (M+)

参考例373

10 $4-(4-\rho$ ロロフェニル) -1-(4-ビドロキシフェニル) ピペリジン-4 ーオール

Ms; 349 (M+-1)

参考例374

1- (4-ヒドロキシフェニル) -4- (4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペリジン-4-オール

Ms: 353 (M+)

5 参考例375

(4-ヒドロキシフェニル) - [4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン-1-イル] メタノン

Ms : 381 (M+)

参考例376

10 1- (4-ヒドロキシフェニル) ピペリジン-4-カルボン酸tertーブチル エステル

 1 H NMR (CDCl₃) δ 1. 46 (9H, s), 1. 76–2. 05 (4H, m), 2. 23–2. 34 (1H, m), 2. 62–2. 73 (2H, m), 3. 39–3. 48 (2H, m), 4. 39–4. 49 (1H, m), 4. 78 (1H, s), 6. 72–6. 78 (2H, m), 6. 82–6. 89 (2H, m)

15 参考例377

4- (4-フェニルピペリジン-1-イル)フェノール

Ms: 253 (M+)

参考例378

4-(4,4-ジエトキシピペリジン-1-イル)フェノール

20 Ms: 265 (M+)

参考例379

2-ジメチルアミノメチルー4ー [4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェノール

Ms: 410 (M+)

25 参考例380

4-(4-[1, 3] ジオキソラン-2-イルピペリジン-1-イル)フェノール

¹H NMR (CDCl₃) δ 1.51—1.70(2H, m), 1.80—1.92(2H, m), 2.53—2.66(2H, m), 3.48—3.57(2H, m), 3.84—3.92(2H, m), 3.92—4.02(2H, m), 4.63(1H, brs),

596

4.69(1H, d, J = 4.9Hz), 6.70-6.78(2H, m), 6.83-6.91(2H, m)

参考例381

4- [4-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン-1-イル] フェノール

5 Ms : 337 (M+)

参考例382

4- (4-ヒドロキシフェノキシ) ピペリジン-1-カルボン酸 t e r t ーブチルエステル

Ms:293 (M+)

10 参考例383

4- [1- (4-トリフルオロメチルフェニル) ピペリジン-4-イルオキシ] フェノール

Ms; 337 (M+)

参考例384

15 4-(1,4-ジオキサ-8-アザスピロ[4,5]デカン-8-イル)フェノ ール

 1 H NMR (CDCl $_{3}$) δ 1.87(4H, t, J=5.7Hz), 3.18(4H, t, J=5.7Hz), 3.99(4H, s), 6.74(2H, d, J=8.9Hz), 6.88(2H, d, J=8.9Hz)

参考例385

20 4-(4-フェニル-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イル) フェノール

Ms: 251 (M+)

参考例386

4- (4-ヒドロキシフェニル) ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチル

25 エステル

¹H NMR (CDCl₃) δ 1.49 (9H, s), 2.95-3.00 (4H, m), 3.55-3.60 (4H, m), 5.77 (1H, s), 6.74-6.86 (4H, m).

参考例387

4- [4-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン-1-イル] フェ

ノール

¹H NMR (CDCl₃) δ 3. 19-3. 24 (4H, m), 3. 29-3. 34 (4H, m), 4. 51 (1H, s), 6. 76-6. 82 (2H, m), 6. 87-6. 97 (4H, m), 7. 11-7. 16 (2H, m).

参考例388

5 4- {4- [(4-トリフルオロメトキシベンジリデン) アミノ] ピペラジンー 1-イル} フェノール

Ms: 349 (M+-1)

参考例389

4- [4-(4-クロロベンジル)ピペラジン-1-イル]フェノール

10 1 H NMR (CDCl₃) δ 2. 60 (4H, t, J=4.8Hz), 3. 08 (4H, t, J=4.8Hz), 3. 53 (2H, s), 6. 71–6. 78 (2H, m), 6. 81–6. 89 (2H, m), 7. 27–7. 42 (4H, m)

参考例390

3- (4-ヒドロキシフェニル) オキサゾリジン-2-オン

¹H NMR (CDCl₃) δ 3.94-4.01(2H, m), 4.35-4.42(2H, m), 6.73-6.80(2H, m),

15 7.29-7.36(2H, m), 9.34(1H, s).

参考例391

4- (4-ピリジル) フェノール

 1 H NMR (CDCl $_{3}$) δ 6.87-6.93(2H, m), 7.60-7.70(4H, m), 8.54-8.57(2H, m), 9.85(1H, s).

20 参考例392

4ーヒドロキシーNー (4ートリフルオロメトキシフェニル) ベンズアミド 1 H NMR (CDC1₃) δ 6.84–6.87(2H, m), 7.31–7.34(2H, m), 7.83–7.87(4H, m), 10.11(1H, brs), 10.15(1H, brs).

参考例393

25 (4-ヒ·ドロキシフェニル) -(4-トリフルオロメトキシフェニル) メタノン 1 H NMR (CDCl₃) δ 6.08(1H, s), 6.92-6.96(2H, m), 7.30-7.33(2H, m), 7.76-7.83(4H, m).

参考例394

(4ーヒドロキシフェニル) - (4ートリフルオロメチルフェニル) メタノン

598

Ms: 266 (M+)

参考例395

4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェノール

 ^{1}H NMR (CDCl3) δ 4.67(1H, brs), 6.81-6.85(2H, m), 6.90-6.96(4H, m),

5 7.13-7.16(2H, m).

表8

参考的	列 R1	NMR or Ms
396	4-C1Ph-	¹ H NMR (CDC1 ₃) δ 1.87-2.01(2H, m), 2.04-2.16(2H, m), 2.91-3.02(2H, m), 3.29-3.39(2H, m), 4.34-4.44(1H, m), 4.85(1H, s), 6.71-6.78(2H, m), 6.82-6.92(4H, m), 7.20-7.26(2H, m).
397	4-CF ₃ Ph-	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.90-2.05(2H, m), 2.08-2.20(2H, m), 2.94-3.05(2H, m), 3.30-3.40(2H, m), 4.46-4.56(1H, m), 4.64(1H, s), 6.72-6.80(2H, m), 6.86-6.93(2H, m), 6.96-7.00(2H, m), 7.52-7.56(2H, m).
398	4-FPh-	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.86-2.00(2H, m), 2.04-2.16(2H, m), 2.90-3.00(2H, m), 3.30-3.40(2H, m), 4.29-4.39(1H, m), 4.72(1H, s), 6.71-6.78(2H, m), 6.83-7.01(6H, m).
399	4-CH ₃ 0Ph-	1 H NMR (CDC1 ₃) δ 1.86-2.00(2H, m), 2.05-2.13(2H, m), 2.88-2.99(2H, m), 3.31-3.41(2H, m), 3.77(3H, s), 4.25-4.35(1H, m), 4.72(1H, s), 6.72-6.77(2H, m), 6.80-6.92(6H, m).
400	4−CH₃Ph−	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.87-2.01 (2H, m), 2.04-2.16 (2H, m), 2.29 (3H, s), 2.90-3.00 (2H, m), 3.30-3.40 (2H, m), 4.33-4.43 (1H, m), 4.85 (1H, s), 6.71-6.78 (2H, m), 6.80-6.92 (4H, m), 7.06-7.10 (2H, m).
401	$-C_6H_5$	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.89-2.03(2H, m), 2.04-2.18(2H, m), 2.92-3.02(2H, m), 3.31-3.41(2H, m), 4.39-4.49(1H, m), 4.92(1H, s), 6.70-6.78(2H, m), 6.84-6.98(5H, m), 7.24-7.33(2H, m). ¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.90-2.04(2H, m), 2.09-2.18(2H, m)
402	4-CNPh-	m), 2.94-3.04(2H, m), 3.29-3.39(2H, m), 4.49- 4.55(1H, m), 6.75-6.80(2H, m), 6.86-6.90(2H,
403	-CH ₂ -cyclo-C ₆ H ₁₁	m), 6.93-7.00(2H , m), 7.55-7.62(2H , m). Ms: 289 (M+) ¹ H NMR (CDC1 ₃)δ 1.54-2.07(11H, m), 2.74-
404		2. 87 (2H, m), 3. 31-3. 43 (2H, m), 3. 47-3. 57 (1H, m), 3. 72-3. 83 (1H, m), 3. 88-3. 98 (1H, m), 4. 74-4. 78 (1H, m), 6. 69-6. 76 (2H, m), 6. 83-6. 88 (2H, m).

表 9



"\o\\\			
参考例	R1	R2	NMR
405	$-\mathrm{CH_3}$	4-CF ₃ OPh-	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 3.23(3H, s), 4.88(1H, s), 6.66-6.73(2H, m), 6.80-6.87(2H, m), 6.99-7.08(4H, m).
406	$-\mathrm{CH_3}$	4-ClPh-	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 3.22(3H, s), 4.69(1H, brs), 6.66-6.68(2H, m), 6.81-6.84(2H, m), 7.01-7.04(2H, m), 7.10-7.13(2H, m).
407	$-CH_3$	4-CF ₃ Ph-	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 3.28(3H, s), 4.80(1H, brs), 6.68-6.71(2H, m), 6.85-6.88(2H, m), 7.06-7.09(2H, m), 7.37-7.40(2H, m). ¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.19(3H, t, J=7.1Hz),
408	$-C_2H_5$	4-CF ₃ OPh-	3.66(2H, q, J=7.1Hz), 4.75(1H, brs), 6.62- 6.66(2H, m), 6.83-6.87(2H, m), 6.98-7.05(4H, m).
409	$^{4 ext{-}}_{ ext{CF}_3 ext{OPhCH}_2 ext{-}}$	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 4.34(1H, bs), 4.49(4H, brs), 6.61-6.72(4H, m), 7.14-7.16(4H, m), 7.24-7.26(4H, m). ¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.21(3H, t, J=7.1Hz),
410	$-\mathrm{C_2H_5}$	4-CF ₃ Ph-	3.70(2H, q, J=7.1Hz), 4.87(1H, brs), 6.62-6.65(2H, m), 6.85-6.91(2H, m), 7.03-7.09(2H, m), 7.34-7.37(2H, m).
411	$-\mathrm{C}_2\mathrm{H}_5$	4-ClPh-	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.17(3H, t, J=7.1Hz), 3.65(2H, q, J=7.1Hz), 4.73(1H, brs), 6.59-6.63(2H, m), 6.82-6.85(2H, m), 6.98-7.03(2H, m), 7.06-7.10(2H, m).
412	$-\mathrm{CH_3}$	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 2.90(3H, s), 4.33(1H, brs), 4.40(2H, brs), 6.66-6.70(2H, m), 6.72-6.76(2H, m), 7.13-7.16(2H, m), 7.25-7.27(2H, m).
413	$-\mathrm{CH_3}$	4-ClPhCH ₂ -	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 2.88(3H, s), 4.34(1H, brs), 4.36(2H, brs), 6.65-6.69(2H, m), 6.71-6.76(2H, m), 7.15-7.18(2H, m), 7.25-7.28(2H, m).
414	$-CH_3$	4-CF ₃ PhCH ₂ -	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 2.92(3H, s), 4.35(1H, brs), 4.46(2H, brs), 6.65-6.68(2H, m), 6.73-6.76(2H, m), 7.34-7.37(2H, m), 7.55-7.58(2H, m).
415	$-\mathrm{C_2H_5}$	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	7.28(2H, m).
416	$\text{-}\mathrm{C}_2\mathrm{H}_5$	$4 ext{-} ext{CF}_3 ext{PhCH}_2 ext{-}$	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.16(3H, t, J=7.0Hz), 3.38(2H, brs), 4.29(1H, brs), 4.45(2H, brs), 6.61-6.70(4H, m), 7.35-7.38(2H, m), 7.54-7.56(2H, m).
417	$-\mathrm{C_2H_5}$	4 -ClPhCH $_2$ -	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.14(3H, t, J=7.0Hz), 3.35(2H, brs), 4.28(1H, brs), 4.36(2H, brs), 6.62- 6.70(4H, m), 7.17-7.19(2H, m), 7.25-7.28(2H,
418	$-\mathrm{COCH_3}$	$-\mathrm{C_6H_5}$	m). ¹ H NMR (CDCl ₃) δ 2.06(3H, s), 6.27(1H, brs), 6.69-6.80(2H, m), 7.08-7.33(7H, m). ¹ H NMR (CDCl ₃) δ 2.06(3H, s), 6.50(1H, brs)
419	-COCH ₃	4-ClPh-	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 2.06(3H, s), 6.50(1H, brs), 6.63-6.85(2H, m), 7.05-7.08(2H, m), 7.18-7.38(4H, m).

表10

参考例	J R1	R2	R3	· NMR
420	-CH ₃	4-CF ₃ OPh-	-F	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 3.22(3H, s), 5.02(1H, brs), 6.57-6.71(4H, m), 7.01-7.14(3H, m).
421	$-\mathrm{CH_3}$	4-ClPh-	-F	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 3.20(3H, s), 5.02(1H, brs), 6.54-6.70(4H, m), 7.07-7.13(3H, m).
422	-CO ₂ CH ₃	$-C_6H_5$	-Н	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 3.75(3H, s), 5.86(1H, brs), 6.69-6.72(2H, m), 7.05-7.08(2H, m), 7.18-7.31(5H, m).
423	-CO ₂ CH ₃	4-C1Ph-	-Н	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 3.75(3H, s), 5.52(1H, brs), 6.73-6.76(2H, m), 7.04-7.07(2H, m), 7.16-7.18(2H, m), 7.26-7.29(2H, m).
424	-COCH ₃	4-CF ₃ Ph-	-Н	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 2.08(3H, s), 6.04(1H, brs), 6.83-6.86(2H, m), 7.09-7.12(2H, m), 7.37-7.40(2H, m), 7.56-7.59(2H, m).
425	-COCH ₃	4-CF ₃ 0Ph-	-Н	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 2.07(3H, s), 6.60-6.92(3H, m), 6.98-7.30(6H, m).
426	-CH ₃ .	$-C_6H_5$	-Н	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 3.24(3H, s), 4.63(1H, brs), 6.76-6.84(5H, m), 7.01-7.05(2H, m), 7.17-7.22(2H, m).
427	-COCH ₃	4-C1Ph-	-F	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 2.07(3H, brs), 6.46-6.61(2H, m), 6.96-7.36(6H, m).
428	-COCH ₃	4-CF ₃ OPh-	- F	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 2.07(3H, brs), 6.48- 6.62(2H, m), 6.90-7.42(6H, m).

表11

参考例	可 R1	R2	NMR or Ms
429	$-C_6H_5$	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 4.72(1H, brs), 4.89(2H, brs), 6.75-6.83(5H, m), 7.05-7.18(6H, m), 7.34-7.37(2H, m).
430	$-C_6H_5$	4-CF ₃ PhCH ₂ -	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 4.67(1H, brs), 4.95(2H, brs), 6.74-6.83(5H, m), 7.06-7.18(4H, m), 7.44-7.47(2H, m), 7.54-7.57(2H, m).
431	$-C_6H_5$	4-C1PhCH ₂ -	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 4.64(1H, brs), 4.86(2H, brs), 6.74-6.82(5H, m), 7.04-7.08(2H, m), 7.12-7.17(2H, m), 7.26(4H, brs).
432	-COCH ₃	4-CF ₃ 0PhCH ₂ -	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.89(3H, s), 4.83(2H, s), 6.54(1H, brs), 6.82(4H, m), 7.09-7.12(2H, m), 7.20-7.26(2H, m).
433	-СH ₃	4-CF ₃ PhCO-	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 3.46(3H, s), 6.28(1H, brs), 6.68-6.71(2H, m), 6.85-6.92(2H, m), 7.33-7.44(4H, m).
434	-CH ₃	4-C1PhC0-	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 3.44(3H, s), 5.12(1H, brs), 6.67-6.72(2H, m), 6.88-6.91(2H, m), 7.13-7.16(2H, m), 7.21-7.24(2H, m).
435	-Н	4-CF ₃ 0PhC0-	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 6.71-6.76(2H, m), 7.48-7.52(4H, m), 8.02-8.05(2H, m), 9.25(1H, s), 10.10(1H, brs).
436	-CH ₃	4-CF ₃ 0PhC0-	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 3.45(3H, s), 6.13(1H, brs), 6.69-6.72(2H, m), 6.87-6.89(2H, m), 6.99-7.02(2H, m), 7.31-7.34(2H, m).
437	−СН ₃	4 –CF $_3$ OPhO (CH $_2$) $_3$ –	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.97-2.06(2H, m), 2.85(3H, s), 3.42(2H, t, J=6.9Hz).
438	-Н	~\sqrt{N}_ci	219 (M+ 1)

表12

	Н	
参考例	R1	NMR or Ms
439	-N O F	Ms: 367 (M+)
440	H ₃ C CI	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 2.96(3H, s), 4.43 (2H, brs), 4.68(1H, s), 6.63-6.6 6(2H, m), 6.76-6.80(2H, m), 7.05-7.08(2H, m), 7.12-7.15(2H, m).
441	O=CH ₃	¹ H NMR (CDC1 ₃) δ 1.90(3H, brs), 4.8 3(2H, s), 5.88(1H, brs), 6.74-6.76 (2H, m), 7.02-7.06(2H, m), 7.10-7.13(2H, m), 7.60-7.63(2H, m).
442	H ₃ C F F	¹ H NMR (CDC1 ₃) δ 3. 06 (3H, s), 4. 52 (2H, s), 4. 70 (1H, s) , 6. 71-6. 81 (4H, m), 7. 05-7. 07 (2H, m), 7. 41-7. 44 (2H, m).
443	H ₃ C F	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 2.99(3H, s), 4.44 (2H, s), 4.68(1H, s), 6.66–6.70 (2H, m), 6.77–6.81(2H, m), 7.04–7.10(4H, m).
444	J-CI	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 3.95(1H, brs), 4.21 (2H, s), 4.69(1H, brs), 6.53-6.56(2H, m), 6.79-6.82(2H, m), 7.09-7.12(2H, m), 7.20-7.23(2H, m).
445	N-FF	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 4. 28 (3H, brs), 4. 71 (1H, brs), 6. 60-6. 63 (2H, m), 6. 79-6. 83 (2H, m), 7. 21-7. 23 (2H, m), 7. 38-7. 40 (2H, m).
446	CH ₃ F	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 2.16(3H, s), 3.45(2H, s), 3.48(2H, s), 4.82(1H, brs), 6.76-6.79(2H, m), 7.14-7.22(4H, m), 7.35-7.38(2H, m).
447	N-OF F	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 4.03(1H, brs), 4. 22(2H, s), 4.72(1H, brs), 6.56-6.69 (2H, m), 6.80-6.83(2H, m), 7.01- 7.04(2H, m), 7.21-7.24(2H, m).

実施例1

2-クロロ-1-(3-クロロ-2-ヒドロキシプロピル) -4-ニトロイミダ ゾールの製造

2-クロロー4-ニトロー1H-イミダゾール(2g、13.56ミリモル) 及びエピクロロヒドリン(1.38g、14.91ミリモル)のアセトニトリル (60ml)溶液に、炭酸水素ナトリウム(1.25g、14.91ミリモル)を加え、4時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に水(20ml)を加え、塩化メチレン(15ml)で2回抽出し、抽出液を硫酸ナトリウムで乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカ ゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル/n-ヘキサン=1/1)にて精製して、微黄色油状物の2-クロロ-1-(3-クロロ-2-ヒドロキシプロピル)-4-ニトロイミダゾール(2.04g、収率63%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

3. 51-3. 70 (2H, m), 4. 02-4. 35 (4H, m), 7. 92 15 (1H, s).

実施例2

2-クロロー4-ニトロー1-(2-オキシラニルメチル) イミダゾールの製造 実施例1で製造した2-クロロー1-(3-クロロー2-ヒドロキシプロピル) -4-ニトロイミダゾール(2.04g、8.5ミリモル) を塩化メチレン (20m1) に溶解し、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセン(DBU)(2.04m1、13.67ミリモル)を加え、室温で終夜撹拌した。反応液を3規定塩酸(20m1)、飽和食塩水(20m1)の順に洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=20/1)にて 特製し、無色油状物の2-クロロー4-ニトロー1-(2-オキシラニルメチル) イミダゾール(190mg、収率11%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

2. 55-2. 69 (1H, m), 2. 97 (1H, t, J=4. 2Hz), 3. 26-3. 43 (1H, m), 3. 94 (1H, dd, J=6. 4Hz, 15.

0Hz), 4. 52 (1H, dd, J=2. 6Hz, 15. 0Hz), 7. 88 (1H, s).

実施例3

2-クロロ-1-(2, 3-ジヒドロキシ-2-メチルプロピル)-4-ニトロ5 イミダゾールの製造

2-クロロー4ーニトロー1Hーイミダゾール(6.78g、46ミリモル)及び4ーニトロ安息香酸2ーメチルー2ーオキシラニルメチルエステル(12g、51ミリモル)を酢酸エチル(24ml)に溶解し、この溶液にトリエチルアミン(1.3ml、9.2ミリモル)を加えて14時間加熱還流した。反応液を減10 圧下に濃縮し、残渣に塩化メチレン(40ml)を加えて結晶化した。得られた結晶を濾取し、メタノール(120ml)に溶解した。炭酸カリウム(318mg、2.3ミリモル)を加え、室温で1時間撹拌した。氷冷下、6規定塩酸(0.8ml)及び硫酸マグネシウム(8g)をこの順に加え、30分撹拌した。不溶物をセライト濾過して除き、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣に酢酸エチル(6ml)及びトルエン(60ml)を加えた。得られた結晶を濾取し、50℃にて乾燥して、白色粉末晶の2ークロロー1ー(2,3ージヒドロキシー2ーメチルプロピル)ー4ーニトロイミダゾール(7.88g、収率72%)を得た。

1 HーNMR(DMSODー6)δ ppm:

1. 02 (3H, s), 3. 25 (2H, d, J=5. 3Hz), 4. 04 (2 20 H, s), 4. 98 (1H, s), 5. 10 (1H, t, J=5. 4Hz), 8. 29 (1H, s).

実施例4

2-クロロ-1- (2-ヒドロキシ-3-メタンスルホニルオキシ-2-メチル プロピル) -4-ニトロイミダゾールの製造

25 実施例 3 で製造した 2 ー クロロー 1 ー (2, 3 ー ジヒドロキシー 2 ー メチルプロピル) ー 4 ー ニトロイミダゾール (5.05g、21.43ミリモル) のピリジン (10ml) 溶液に、氷冷攪拌下、メタンスルホニルクロリド (2.01ml、25.72ミリモル) を加え、室温で1.5時間攪拌した。6 N塩酸を加え酢酸エチルで抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮して黄色油状物の

2-クロロー1-(2-ヒドロキシー3-メタンスルホニルオキシー2-メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾール(6.72g、定量的)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 31 (3H, s), 2. 10 (1H, s), 3. 11 (3H, s), 4. 0 5 8-4. 23 (4H, m), 8. 02 (1H, s).

実施例5

2-クロロ-1-[2-ヒドロキシ-2-メチル-3-(4-メチルベンゼンスルホニルオキシ)プロピル]-4-ニトロイミダゾールの製造

2-クロロー4-ニトロー1H-イミダゾール(1g、6.78ミリモル)及

びパラトルエンスルホン酸2-メチルー2-オキシラニルメチルエステル(2.46g、10.15ミリモル)、ベンジルトリエチルアンモニウムクロリド(150mg、0.66ミリモル)及びアセトニトリル(10ml)の混合物を8時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、酢酸エチルにより希釈し、飽和重曹水により2回洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=6/1)により精製し、微黄色オイルの2-クロロー1-[2-ヒドロキシー2-メチルー3-(4-メチルベンゼンスルホニルオキシ)プロピル]-

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

20 1. 25 (3H, s), 2. 46 (3H, s), 2. 80 (1H, s), 3. 9
1 (1H, d, J=10. 4Hz), 3. 95 (1H, d, J=10. 4Hz),
4. 04-4. 16 (2H, m), 7. 38 (2H, d, J=8. 0Hz), 7.
76 (2H, d, J=8. 0Hz), 7. 93 (1H, s).

4-ニトロイミダゾール (1.86g、収率70%) を得た。

実施例 6

25 2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダ ゾールの製造

実施例4で製造した2ークロロー1ー(2ーヒドロキシー3ーメタンスルホニルオキシー2ーメチルプロピル)-4ーニトロイミダゾール(6.72g、21.43ミリモル)を、実施例2と同様に処理して、白色粉末結晶の2ークロロー1

-(2-メチルー2-オキシラニルメチル) -4-ニトロイミダゾール (5.6 g, 収率94%) を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 39 (3H, s), 2. 62 (2H, d, J=4.0Hz), 2. 78 (1 H, d, J=4.0Hz), 4. 00 (1H, d, J=14.9Hz), 4. 3

8 (1H, d, J=14.9Hz), 7.87 (1H, s).

実施例7

2-クロロ-1- (2-メチル-2-オキシラニルメチル) -4-ニトロ-1H -イミダゾールの製造

- 10 実施例5で製造した2-クロロ-1-[2-ヒドロキシ-2-メチル-3-(4-メチルベンゼンスルホニルオキシ)プロピル]-4-ニトロイミダゾール (1.11g、2.84ミリモル)を用い、実施例2と同様の方法により、微黄 色粉末結晶の2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール(523mg、収率85%)を得た。
- 15 得られた化合物の物性は、実施例6で得られた化合物の物性と同一であった。 実施例8
 - (R) -2-クロロ-1- [2-ヒドロキシ-3-(4-メチルベンゼンスルホ ニルオキシ) プロピル] -4-ニトロイミダゾールの製造

2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール(10g、67.79ミリモ

- 20 ル)及び(R) (-) グリシジルトシレート(17.02g、74.58ミリモル)をアセトニトリル(50ml)に溶解し、この溶液に炭酸水素ナトリウム(6.26g、74.15ミリモル)を加えて3.5時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、濾過後、濾液を減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル/n-ヘキサン=1/2)にて精製して、微黄色油状
- 25 物の(R) -2-クロロ-1-[2-ヒドロキシ-3-(4ーメチルベンゼンスルホニルオキシ)プロピル]-4-ニトロイミダゾール(16.9g、収率66%)を得た。
 - ¹H-NMR (CDCl₃) δppm:
 - 2. 47 (3H, s), 3. 65 (1H, d, J=5. 8Hz), 3. 93-4.

33 (5H, m), 7. 38 (2H, d, J=8. 3Hz), 7. 70 (2H, d, J=8. 3Hz), 7. 86 (1H, s).

実施例9

(R) -2-クロロー4-ニトロー1-(2-オキシラニルメチル) イミダゾー5 ルの製造

2-クロロー4-ニトロー1H-イミダゾール(1g、6.78ミリモル)及び(R)-(ー)ーグリシジルトシレート(1.7g、7.45ミリモル)をテトラヒドロフラン(THF)(10ml)に溶解し、この溶液に炭酸水素ナトリウム(600mg、7.14ミリモル)を加え、11時間加熱環流した。反応液を減圧下にて濃縮後、水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機相を水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過した。濾液を濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル/n-ヘキサン=1/1)にて精製し、微黄色油状物の(R)-2-クロロー4-ニトロー1-(2-オキシラニルメチル)イミダゾール(1.45g、収率57%)を得た。

15 光学純度79.2%ee

 $[\alpha]_{D}^{27} = 42.55^{\circ}$ (濃度:1.262, CHCl₃)

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

2. 61 (1H, t, J=2. 5Hz, 4. 3Hz), 2. 97 (1H, t, J=4. 3Hz), 3. 25-3. 34 (1H, m,), 3. 95 (1H, dd,

20 J=6.4Hz, 15.0Hz), 4.51 (1H, dd, J=2.6Hz, 1 5.0Hz), 7.88 (1H, s).

実施例10

- (R) -2-クロロ-1-(2, 3-ジヒドロキシ-2-メチルプロピル) -4 -ニトロイミダゾールの製造
- 25 2-クロロー4ーニトロー1Hーイミダゾール(600g、4.07モル)及び(R)-4ーニトロ安息香酸2ーメチルー2ーオキシラニルメチルエステル(1060g、4.47モル)を酢酸エチル(2124ml)に溶解し、この溶液にトリエチルアミン(113.64ml、0.82モル)を加えて16時間加熱還流した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣に酢酸エチル(530ml)、ト

ルエン (5300m1) を加えて結晶化した。得られた結晶を濾取し、メタノール (10.61) に溶解した。この溶液に炭酸カリウム (55.4g、0.4モル)を加え、室温で1時間撹拌した後、氷冷下、濃塩酸 (66m1) 及び硫酸マグネシウム (671g)をこの順に加え、30分撹拌した。不溶物をセライト濾過し、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣に酢酸エチル (530m1) 及びトルエン (5300m1) を加えた。得られた結晶を濾取し、50℃にて乾燥して、淡茶粉末結晶の (R) -2-クロロ-1-(2,3-ジヒドロキシ-2-メチルプロピル) -4-ニトロイミダゾール (879.1g、収率92%)を得た。光学純度99.0%ee

10 [α] $_{D}^{27}$ =17.38° (濃度:1.03, DMSO) $_{D}^{1}$ H-NMR (DMSO- $_{G}^{1}$) δ p p m: 1.01 (3H, s), 3.25 (2H, d, J=5.3Hz), 4.05 (2H, s), 5.01 (1H, s), 5.11 (1H, t, J=5.4Hz), 8.32 (1H, s)。

15 実施例11

(R) -2-クロロ-1- (2-ヒドロキシ-3-メタンスルホニルオキシ-2 -メチル) プロピル-4-ニトロイミダゾールの製造

実施例10で製造した(R) -2-クロロ-1-(2,3-ジヒドロキシ-2-メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾール(879g、3.73モル)をピ20 リジン(1778m1)に溶解し、5℃に冷却した。これに塩化メタンスルホニル(432.7m1、5.59モル)を15℃以下にて徐々に滴下した後、同温度で1時間撹拌した。これに6規定塩酸(5500m1)を30℃以下にて加え、氷冷下にて40分撹拌した。析出晶を濾取し、水、トルエンの順に洗浄し、一次晶を得た。また濾液より酢酸エチル(5リットル)にて2回抽出し、抽出液を水25 洗後、硫酸マグネシウムで乾燥し、濾過後、濾液を減圧濃縮し、トルエンを加えることにより得られた結晶を濾取し、二次晶を得た。一次晶及び二次晶を合わせ、60℃にて乾燥して、白色粉末結晶の(R)-2-クロロ-1-(2-ヒドロキシー3-メタンスルホニルオキシー2-メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾール(942.6g、収率81%)を得た。

 1 H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

1. 12 (3H, s), 3. 23 (3H, s), 4. 09 (2H, s), 4. 1 3 (2H, s), 5. 60 (1H, br), 8. 34 (1H, s)。 実施例12

5 (R) -2-クロロ-1- (2-メチル-2-オキシラニルメチル) -4-ニトロイミダゾールの製造

- 10 m1、3.3モル)を加え、室温で1時間撹拌した。反応液を水(5リットル)にて洗浄した。水層を酢酸エチル(5リットル)により2回抽出した。抽出液と有機相とを合わせ、飽和食塩水(5リットル)にて洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、濾過した。濾液を減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル/n-ヘキサン=1/2)にて精製し、白色粉末結晶の
- 15 (R) -2-クロロー1-(2-メチルー2-オキシラニルメチル) -4-ニトロイミダゾール(600.7g、収率92%)を得た。

光学純度98.8%ee

 $[\alpha]_{D}^{26} = 31.11^{\circ}$ (濃度:2.02, CHCl₃)

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

20 1.38 (3H, s), 2.62 (1H, d, J=4.0Hz), 2.78 (1H, d, J=4.0Hz), 4.00 (1H, d, J=14.9Hz), 4.3 (1H, d, J=14.9Hz), 7.87 (1H, s)。 实施例13

(R) - 2 - クロロ - 1 - [2 - ヒドロキシ - 2 - メチル - 3 - (4 - メチルベ)

25 ンゼンスルホニルオキシ) プロピル] -4-ニトロイミダゾールの製造

 $2-\rho$ ロロー4ーニトロー1 Hーイミダゾール(18.4g、125ミリモル)及び(R)-4ーメチルベンゼンスルホン酸2ーメチルー2ーオキシラニルメチルエステル(36.2g、149ミリモル)をアセトニトリル(150 m 1)に懸濁し、これにベンジルトリエチルアンモニウムクロリド(5.7g、

25ミリモル)を加え、8時間加熱還流した。反応液を減圧下にて濃縮した。残 渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=20/ 1)により精製し、白色アモルファスの(R)-2-クロロ-1-[2-ヒドロ キシ-2-メチル-3-(4-メチルベンゼンスルホニルオキシ)プロピル]-4-ニトロイミダゾール(20.1g, 43%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

- 1. 24 (3H, s), 2. 47 (3H, s), 2. 81 (1H, s), 3. 9 0 (1H, d, J=10.4Hz), 3. 95 (1H, d, J=10.4Hz),
- 4. 04-4.14 (2H, m), 7. 39 (2H, d, J=8.0Hz), 7.
- 10 76 (2H, d, J=8.0Hz), 7.91 (1H, s).

実施例14

(R) -2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル) -4-ニトロイミダゾールの製造(実施例12の化合物の別途合成法)

2-クロロー4-ニトロー1H-イミダゾール(1.51g、10.17ミリ モル)及び(R)-4-メチルベンゼンスルホン酸2-メチルー2-オキシラニルメチルエステル(3.70g、15.25ミリモル)をアセトニトリル(15 m1)に懸濁し、これにベンジルトリエチルアンモニウムクロリド(0.23、1.02ミリモル)を加え、10時間加熱還流した。反応液を室温に戻した後、酢酸エチルを加え、炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾20 燥後、濾過した。濾液を減圧濃縮し、酢酸エチル(40m1)に溶解した。氷冷攪拌下、DBU(1.57m1、10.17ミリモル)を加え、更に室温で1.5時間攪拌した。反応液を水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(nーヘキサン/酢酸エチル=7/3)にて精製し、微黄色油状物の(R)-2-クロロー1-(2-メチルー25 2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール(1.50g、収率68%)を得た。

実施例15

(S) -2-クロロー4-ニトロー1- [2-ヒドロキシー3-(4-ニトロベンゾイルオキシ) -2-メチルプロピル] イミダゾールの製造

2-クロロー4-ニトロー1H-イミダゾール(3g、20.34ミリモル)及び(S)-4-ニトロ安息香酸2-メチルー2-オキシラニルメチルエステル(5.31g、22.37ミリモル)を酢酸エチル(10ml)に溶解し、この溶液にトリエチルアミン(0.57ml、4.07ミリモル)を加え60-65℃にて10時間撹拌した。反応液を減圧下にて濃縮した。残渣に酢酸エチル(3ml)及びトルエン(30ml)を加え、得られた結晶を濾取して、黄色粉末結晶の(S)-2-クロロー4-ニトロー1-[2-ヒドロキシー3-(4-ニトロベンゾイルオキシ)-2-メチルプロピル]イミダゾール(6.82g、収率87%)を得た。

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ p p m:
1. 23 (3H, s), 4. 11-4. 33 (4H, m), 5. 61 (1H, s), 8. 25 (2H, d, J=8. 9Hz), 8. 31-8. 45 (3H, m).

実施例16

15 (S) -2-クロロ-1-(2, 3-ジヒドロキシ-2-メチルプロピル) -4-ニトロイミダゾールの製造

実施例15で製造した(S)-2-クロロー4-ニトロー1-「2-ヒドロキ

シー3ー(4ーニトロベンゾイルオキシ) -2ーメチルプロピル] イミダゾール (6.8g、17.67ミリモル) をメタノール (68ml) に溶解し、炭酸カ20 リウム (122mg、0.88ミリモル) を加え、室温にて終夜撹拌した。氷冷し6規定塩酸 (0.3ml) 及び硫酸マグネシウム (3g) をこの順に加え30分撹拌した。不溶物をセライト濾過し、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣に酢酸エチル (3.4ml) 及びトルエン (34ml) を加え、得られた結晶を濾取して黄色粉末結晶の (S) -2-クロロー1ー (2,3-ジヒドロキシー2ーメチ

 1 ルプロピル)-4-ニトロイミダゾール(4.09g、収率97%)を得た。 1 H-NMR(DMSO-d $_{6}$) δ p p m:

1. 02 (3H, s), 3. 25 (2H, d, J=5. 3Hz), 4. 05 (2 H, s), 4. 98 (1H, s), 5. 11 (1H, t, J=5. 2Hz), 8. 30 (1H, s).

実施例17

(S) -2-クロロー1-(2-ヒドロキシー2-メチルー3-メタンスルホニルオキシプロピル) -4-ニトロイミダゾールの製造

実施例16で製造した(S) -2-クロロ-1-(2, 3-ジヒドロキシ-2 -メチルプロピル) -4-ニトロイミダゾール(4.05g、16.9ミリモル)をピリジン(8ml)に溶解し、4℃まで冷却した。塩化メタンスルホニル(1.6ml、20.28ミリモル)を15℃以下にて徐々に滴下し、更に同温度下にて1時間撹拌した。6規定塩酸(33ml)を30℃以下にて滴下した。反応混合物を塩化メチレン(20ml)で3回抽出し、有機相を合わせ、水(20ml)及び飽和食塩水(20ml)で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣にトルエン(10ml)を加え、得られた結晶を濾取して、白色粉末結晶の(S) -2-クロロ-1-(2-ヒドロ

キシー2-メチルー3-メタンスルホニルオキシプロピル) -4-ニトロイミダ

15 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δppm:
1. 12 (3H, s), 3. 24 (3H, s), 4. 09 (2H, s), 4. 1
3 (2H, s), 5. 62 (1H, br), 8. 34 (1H, s)。
実施例18

ゾール(3.04g、収率57%)を得た。

(S) -2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル) -4-ニト 20 ロイミダゾールの製造

実施例17で製造した(S)-2-クロロー1-(2-ヒドロキシ-2-メチ

ルー3ーメタンスルホニルオキシプロピル) -4ーニトロイミダゾール (3.02g、9.51ミリモル) を塩化メチレン (30ml) に溶解し、DBU (1.7ml、11.41ミリモル) を加え、室温下にて1.5時間撹拌した。反応液 を3規定塩酸30ml、飽和食塩水20mlの順に洗浄し、硫酸マグネシウムで 乾燥した後、減圧濾過した。濾液を濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=20/1) にて精製し、微黄色油状物の (S) -2-クロロー1- (2-メチル-2-オキシラニルメチル) -4-ニトロイミダゾール (1.89g、収率91%) を得た。

光学純度93.2%ee

 $[\alpha]_{D}^{27} = -29.15^{\circ}$ (濃度: 1.18, CHCl₃)

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 39 (3H, s), 2. 63 (1H, d, J=4.0Hz), 2. 79 (1

5 H, d, J=4.0Hz), 4.00 (1H, d, J=14.9Hz), 4.3 8 (1H, d, J=14.9Hz), 7.88 (1H, s).

実施例19

2-tert-ブトキシメチルー6ーニトロー2, 3ージヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造

- 10 2,4-ジニトロー1Hーイミダゾール(10g、63.3ミリモル)、2-tert-ブトキシメチルオキシラン(27ml、189ミリモル)及び酢酸ナトリウム(5.19g、189ミリモル)をエタノール(100ml)に懸濁し、この懸濁液を17時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に水を加え、塩化メチレンで抽出し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濾過し
- 15 た。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=50/1) にて精製し、白色粉末結晶の2ー tert-ブトキシメチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (3.2 g, 収率21%) を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 18 (9H, s), 3. 63-3. 80 (2H, m), 4. 22-4. 36 (2H, m), 5. 27-5. 42 (1H, m), 7. 53 (1H, s)。
 2-メチル-2-(2-メトキシメトキシエチル)オキシラン、2-エチルー2-メトキシメトキシメチルオキシラン又は2-イソプロピルー2-メトキシメトキシメトキシメチルオキシランを用い、実施例19と同様にして、実施例20~実施例25 22の化合物を製造した。

実施例20

2-(2-メトキシメトキシエチル)-2-メチル-6-ニト-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール白色粉末結晶、収率4.8%、MS=2.5.7。

実施例21

2-xチルー2-xトキシメトキシメチルー6-xトロー2, 3-xビドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

微黄色粉末結晶、収率49%

 1 H-NMR (DMSO-d₆) δ p p m: 0. 91 (3H, t, J=7. 5Hz), 1. 91 (2H, q, J=7. 5 Hz), 3. 24 (3H, s), 3. 72 (1H, d, J=11. 2Hz), 3. 78 (1H, d, J=11. 2Hz), 4. 15 (1H, d, J=11. 2 Hz), 4. 23 (1H, d, J=11. 2Hz), 4. 59 (2H, s), 8.

実施例22

10 (1H, s).

10

2- 1 プロピルー2- 3 トキシメトキシメチルー6- 1 ー 2 、3- 3 ビド ロイミダゾ [2, 1- b] オキサゾール

微黄色粉末結晶、収率90%

20 s).

実施例23

2-クロロ-1-(2-ヒドロキシ-4-メトキシメトキシブチル)-4-ニトロイミダゾールの製造

2-クロロー4-ニトロー1 Hーイミダゾール(5.74g、38.93ミリ 25 モル)のエタノール(60ml)溶液に酢酸ナトリウム(3.51g、42.8 2ミリモル)及び2-(2-メトキシメトキシエチル)オキシラン(10.3g、77.86ミリモル)を加え、13.5時間加熱還流した。エタノールを減圧留去し、残渣に水を加え、塩化メチレンで抽出した。硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタ

ノール=100/1)にて精製した。塩化メチレン及びジイソプロピルエーテルで結晶化させ、微黄色粉末結晶の2-クロロー1-(2-ヒドロキシ-4-メトキシブチル)-4-ニトロイミダゾール(8.51g、収率78%)を得た。

- 5 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:
 - 1. 67 (2H, m), 3. 38 (3H, s), 3. 46 (1H, d, J=2. 4Hz), 3. 78-3. 83 (2H, m), 4. 00 (1H, dd, J=7. 6Hz, 14. 3Hz), 4. 11-4. 21 (2H, m), 4. 63 (2H, s), 7. 96 (1H, s).
- 10 2-メチルー2-メトキシメトキシメチルオキシランを用い、実施例23と同様にして、実施例24の化合物を製造した。

実施例24

2-クロロー1-(2-ヒドロキシ-3-メトキシメトキシプロピル)-4-ニ トロイミダゾール

15 無色液体、収率63%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 20 (3H, s), 3. 08 (1H, s), 3. 42 (3H, s), 3. 5
3 (2H, q, J=10. 4Hz, 13. 8Hz), 4. 67 (2H, s), 8.
01 (1H, s)

20 実施例25

2-(2-メトキシメトキシエチル)-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造

実施例23で製造した2-クロロ-1-(2-ヒドロキシ-4-メトキシメトキシ)ブチル-4-ニトロイミダゾール(8.45g、30.21ミリモル)の25 1,4-ジオキサン(100ml)溶液に氷冷攪拌下、水素化ナトリウム(1.33g、33.23ミリモル)を加え、40時間加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、氷冷して残渣に水を加えて、塩化メチレンで抽出した。硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=100/1)にて精製し、塩化メチレン及びジイソプロピル

エーテルで結晶化させ、微黄色粉末結晶の2-(2-メトキシメトキシエチル) -6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (3.4 1 g、収率 4 7 %) を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

5 2. 11-2. 35 (2H, m), 3. 36 (3H, s), 3. 75 (2H, dd, J=4. 8Hz, 6. 8Hz), 4. 08 (1H, dd, J=7. 6Hz, 10. 3Hz), 4. 40 (1H, dd, J=7. 6Hz, 10. 3Hz), 4. 61 (2H, s), 5. 43-5. 54 (1H, m), 7. 53 (1H, s)。 実施例24で製造した2-クロロー1-(2-ヒドロキシー3-メトキシメト

10 キシプロピル) -4-ニトロイミダゾールを用い、実施例25と同様にして、実 施例26の化合物を製造した。

実施例26

15 微黄色粉末結晶、収率38%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 66 (3H, s), 3. 34 (3H, s), 3. 63 (1H, d, J=11. 0Hz), 3. 84 (1H, d, J=11. 0Hz), 3. 93 (1H, d, J=9. 9Hz), 4. 62 (2H,

20 s), 7. 52 (1H, s)

実施例27

実施例10で製造した(R)-2-クロロー1-(2,3-ジヒドロキシー2
25 ーメチルプロピル)-4-ニトロイミダゾール(7.4g、31ミリモル)を塩化メチレン(120ml)に懸濁し、これにN-エチルジイソプロピルアミン(13.1ml、74ミリモル)及びクロロメチルメチルエーテル(7.1ml,74ミリモル)を加え、室温で46時間攪拌した。反応液を水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ

- ー(塩化メチレン/酢酸エチル= 9 / 1)にて精製し、微黄色液体の(R) -2 2 4
- 5 1. 20 (3H, s), 3. 08 (1H, s), 3. 42 (3H, s), 3. 5 0 (1H, d, J=10. 4Hz), 3. 55 (1H, d, J=10. 4Hz), 4. 05 (1H, d, J=14. 4Hz, 4. 15 (1H, d, J=14. 4Hz), 4. 67 (2H, s), 8. 01 (1H, s)。 実施例 28
- 10 (R) -2-メトキシメトキシメチル-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジェ ドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造

実施例27で製造した(R) -2-クロロ-1-(2-ヒドロキシ-3-メトキシメトキシ-2-メチルプロピル) -4-ニトロイミダゾール(6.0g、21ミリモル)のDMF(30m1)溶液に氷冷攪拌下、水素化ナトリウム(1.

15 0g, 25ミリモル)を加え、室温で1, 5時間攪拌した。反応液に氷水を加え、 析出物を濾取し、水で洗浄して、黄色固体の(R)-2-メトキシメトキシメチ ル-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサ ゾール(3. 1g、収率59%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

20 1. 66 (3H, s), 3. 34 (3H, s), 3. 63 (1H, d, J=11. 0Hz), 3. 84 (1H, d, J=11. 0Hz), 3. 93 (1H, d, J=10. 0Hz), 4. 42 (1H, d, J=10. 0Hz), 4. 63 (2H, s), 7. 52 (1H, s)

実施例29

25 2-クロロー1-(5-アセトキシ-2-ヒドロキシ-2-メチルペンチル) -4-ニトロイミダゾールの製造

 $2-\rho$ ロロー4ーニトロー1Hーイミダゾール(6.8g、43ミリモル)、 2ー(3ーアセトキシプロピル)-2ーメチルオキシラン(5.8g、39.3 ミリモル)及び酢酸ナトリウム(3.9g、47.6ミリモル)をエタノール (60ml) に懸濁し、この懸濁液を終夜加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に水を加え、塩化メチレンで2回抽出した。有機相を合わせ、飽和重曹水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、淡茶油状物の2-クロロ-1-

5 (5-アセトキシー2-ヒドロキシー2-メチルペンチル)ー4-ニトロイミダ ゾール(9.5g、収率79%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

- 1. 21 (3H, s), 1. 50-1. 81 (4H, m), 2. 05 (3H,
- s), 3.91-4.12(4H, m), 8.02(1H, s).
- 10 実施例30

2-(3-アセトキシプロピル) -2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ <math>[2, 1-b] オキサゾールの製造

実施例29で製造した2-クロロ-1-(5-アセトキシ-2-ヒドロキシ-2-メチルペンチル)-4-ニトロイミダゾール(9.5g、31.1ミリモ

- 15 ル)を用い、実施例25と同様の方法により、微橙色粉末の2-(3-アセトキシ)プロピル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(5.2g、収率62%)を得た。
 - ¹H-NMR (CDCl₃) δppm:
 - 1. 67 (3H, s), 1. 67-2.00 (4H, m), 2. 05 (3H, m)
- 20 s), 3.91-4.14(4H, m), 7.52(1H, s)。 実施例31
 - 2-(2-ヒドロキシエチル) -6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造

実施例25で製造した2-(2-メトキシメトキシエチル)-6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール(0.2g、0.822ミリモル)の塩化メチレン(10ml)溶液にトリフルオロ酢酸(2ml)を加え、更に室温で終夜攪拌した。減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=100/1)により精製し、メタノール及びジイソプロピルエーテルで結晶化させ、微黄色粉末結晶の2-(2-ヒドロキシ

エチル) -6 ーニトロー 2, 3 ージヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (0.11g、収率 65%)を得た。

 1 H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

1. 92-2. 14 (2H, m), 3. 52-3. 63 (2H, m), 4. 05
5 (1H, dd, J=7. 6Hz, 10. 6Hz), 4. 43 (1H, dd, J=7. 6Hz, 10. 6Hz), 4. 72 (1H, t, J=2. 7Hz), 5. 3
8-5. 53 (1H, m), 8. 12 (1H, s).

実施例32

2-ヒドロキシメチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b]

10 オキサゾールの製造

実施例19で製造した2-tert-ブトキシメチル-<math>6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (5.82g, 24.1ミリモル)を用い、実施例31と同様に反応を行い、白色粉末結晶の2-ヒドロキシメチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (4.

15 25g、収率95%)を得た。

 1 H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

3. 55-3. 67 (1H, m), 3. 72-3. 88 (1H, m), 4. 12 (1H, dd, J=6. 5Hz, 10. 5Hz), 4. 36 (1H, t, J=1 0. 4Hz), 5. 25-5. 50 (2H, m), 8. 11 (1H, s)

20 実施例33

25

2-ヒドロキシメチルー2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造

実施例26で製造した2-メトキシメトキシメチル-2-メチル-6-ニトロー2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(4.14g、38ミリモル)を用い、実施例31と同様に反応を行い、微黄色粉末結晶の2-ヒドロキシメチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-

融点 166-168℃

 1 H-NMR (DMSO- $_{6}$) δ ppm:

b] オキサゾール(2.17g、収率64%)を得た。

1. 51 (3H, s), 3. 53 (1H, d, J=12. 1Hz), 3. 64 (1H, d, J=12. 1Hz), 4. 03 (1H, d, J=10. 6Hz), 4. 24 (1H, d, J=10. 6Hz), 5. 40 (1H, br), 8. 10 (1H, s).

5 実施例34

2-(2-ビドロキシエチル)-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジビドロイミダゾ「2, 1-b] オキサゾールの製造

10 52. 1ミリモル)を用い、実施例31と同様に反応を行い、微黄色粉末結晶の 2-(2-ビドロキシエチル)-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジビドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール(2, 32g、収率21%)を得た。 1 H-NMR(DMSO-d $_6$) δ ppm:

1. 58 (3H, s), 1. 93-2. 17 (2H, m), 3. 59 (2H, t,

15 J=6.4Hz), 4.04 (1H, d J=10.9Hz), 4.33 (d, 1H, J=10.9Hz), 8.11 (1H, s).

実施例35

2-xチルー2-ヒドロキシメチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造

実施例21で製造した2-エチル-2-メトキシメトキシメチル-6-ニトロー2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(21.5g、83.7ミリモル)をメタノール(430ml)に懸濁し、これに濃塩酸(2.15ml)を加え、5時間加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、析出物を濾取して、微黄色粉末結晶の2-エチル-2-ヒドロキシメチル-6-ニトロ-2,3-ジ25 ヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(7.14g、収率40%)を得た。
 ¹ H-NMR (DMSO-d₆) δ p p m:
 0.89(3H,t,J=7.4Hz),1.95(2H,q,J=7.4

Hz), 3. 53-3. 69 (2H, m), 4. 08 (1H, d, J=10.8 Hz), 4. 21 (1H, d, J=10.8Hz), 5. 39 (t, 1H, J=10.8Hz)

5. 6Hz), 8. 09 (1H, s).

対応する出発原料を用い、実施例35と同様にして、実施例36の化合物を製造した。

実施例36

5 2ーヒドロキシメチルー2ーイソプロピルー6ーニトロー2, 3ージヒドロイミ ダゾ [2, 1-b] オキサゾール

微黄色粉末結晶、収率50%

 1 H-NMR (DMSO-d₆) δ p p m:

0. 91 (6H, d, J=6.9Hz), 2. 12-2.23 (1H, m), 3.

10 60-3.77 (2H, m), 4. 16 (2H, s), 5. 35 (1H, t, J = 5.6Hz), 8. 08 (1H, s).

実施例37

(R) - 2 - Eドロキシメチルー $2 - \lambda$ チルー6 - Eトロー2, $3 - \mathcal{Y}$ Eドロイミダゾ[2, 1 - b]オキサゾールの製造

実施例28で製造した(R) -2-メトキシメトキシメチル-2-メチル-6 -ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b] オキサゾール(3.1g、13ミリモル)の塩化メチレン(30m1)溶液にトリフルオロ酢酸(15m1)を加え、更に室温で25時間攪拌した。反応液を減圧濃縮し、メタノールを加え、減圧濃縮した。残渣に2-プロパノールを加え、析出晶を濾取し、2-20 プロパノールで洗浄し、微黄色粉末結晶の(R) -2-ヒドロキシメチル-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b] オキサゾール(1.2g、収率46%)を得た。

融点 162-163℃

光学純度 97%ee

25 [α]_D²⁶=-19.01°(濃度:0.526, DMSO)。 実施例38

2-メチルー2-(3-ヒドロキシプロピル)-6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ「2, 1-b] オキサゾールの製造

実施例30で製造した2-(3-アセトキシプロピル)-2-メチル-6-ニ

トロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (3.2g、11.88ミリモル)、炭酸カリウム (320mg、2.32ミリモル)及びメタノール (35ml)の混合物を室温で2時間撹拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=25/1)にて精製し、微黄色粉末の2-メチルー2ー(3-ヒドロキシプロピル)-6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (2.1g、78%)を得た。

 $^{1}H-NMR$ (CDCl₃) δ ppm:

1. 67-1. 72 (5H, m), 1. 91-2. 07 (2H, m), 3. 51
10 -3. 65 (2H, m), 4. 01 (1H, d, J=10. 5Hz), 4. 15
(1H, d, J=10. 5Hz), 7. 66 (1H, s)。
実施例39

メタンスルホン酸 3-(2-メチル-6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2-イル) プロピルエステルの製造

- 実施例38で製造した2-メチル-2-(3-ヒドロキシプロピル)-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール(2.1g、9.24ミリモル)、トリエチルアミン(2.8g、20.09ミリモル)、4-ジメチルアミノピリジン(50mg、0.41ミリモル)及び塩化メチレン(80ml)の混合物に氷冷下にて、メタンスルホニルクロリド(1.4ml、18.
- 20 09ミリモル)を塩化メチレン10m1に溶解した溶液を徐々に滴下し、室温で終夜撹拌した。反応液を濃縮し、残渣に10%塩酸を加え、氷冷下にて30分撹拌した。析出晶を濾取し、水洗することにより、白色粉末のメタンスルホン酸 3-(2-x+2)-6-1100円に溶解した溶液を徐々に滴下し、室温で終夜撹拌した。大田晶を濾取し、水洗することにより、白色粉末のメタンスルホン酸 3-(2-x+2)110円に溶解した溶液を徐々に滴下し、室温で終むます。
- 25 1 H-NMR (DMSO-d₆) δ p p m: 1. 58 (3H, s), 1. 65-2. 02 (4H, m), 3. 17 (3H, s), 4. 05-4. 26 (4H, m), 8. 12 (1H, s).

対応する出発原料を用い、実施例39と同様にして、実施例40~実施例42 の化合物を製造した。 実施例40

メタンスルホン酸6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b] オキサ ゾール-2-イルメチルエステル

微黄色粉末、収率82%

5 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

3. 25 (3H, s), 4. 11 (1H, dd, J=6. 6Hz, 11. 0 Hz), 4. 47 (1H, t, J=9. 1Hz), 4. 55-4. 70 (2H, m), 5. 60-5. 75 (1H, m), 8. 14 (1H, s).

実施例41

10 メタンスルホン酸2-メチルー6-ニトロー2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールー2-イルメチルエステル

微黄色粉末、収率87%

 1 H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

1. 64 (3H, s), 3. 24 (3H, s), 4. 17 (1H, d, J=11.

15 2Hz), 4. 27 (1H, d, J=11. 2Hz), 4. 52 (2H, br), 8. 14 (1H, s).

実施例42

メタンスルホン酸2- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イル) エチルエステル

20 微黄色粉末、収率87%

 $^{1}H-NMR$ (DMSO-d₆) δ ppm:

1. 61 (3H, s), 2. 38 (2H, t, J=6. 5Hz), 3. 19 (3 H, s), 4. 11 (1H, d, J=11. 0Hz), 4. 25 (1H, d, J=11. 0Hz), 4. 36 (2H, t, J=6. 5Hz), 8. 14 (1H,

25 s).

実施例43

5- (2-クロロー4-ニトロイミダゾール-1-イル) -4-ヒドロキシ-4 -メチルペンタン酸tert-ブチルエステルの製造

3-(2-メチル-2-オキシラニル)プロピオン酸tertーブチルエステ

ル (1.00g、5.39ミリモル)及び2-クロロー4-ニトロー1H-イミダゾール (0.53g、3.59ミリモル)のエタノール (5ml) 懸濁液に酢酸ナトリウム (0.59g、7.18ミリモル)を加え、6時間加熱還流した。不溶物を濾過して除き、濾液を減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=100/1)により精製し、微黄色油状物の5-(2-クロロー4-ニトロイミダゾール-1-イル)-4-ヒドロキシー4-メチルペンタン酸tertーブチルエステル (0.94g、収率78%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

10 1.17(3H, s), 1.45(9H, s), 1.78-1.87(2H, m), 2.43-2.54(2H, m), 3.59(1H, br), 3.99(2H, s), 8.06(1H, s)。 実施例44

3- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキ 15 サゾール-2-イル) プロピオン酸 t e r t - ブチルエステルの製造 実施例43で製造した5- (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イ

- 20 熱還流した。反応液を減圧濃縮し、水を加え、塩化メチレンで抽出して硫酸マグネシムで乾燥後、減圧濃縮した。ジエチルエーテルで洗浄し、白色固体の3ー (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イル)プロピオン酸 t e r t -ブチルエステル(0. 3 5 g、4 2%)を得た。
- 25 ¹H-NMR (CDCl₃) δppm:
 1. 45 (9H, s), 1. 65 (3H, s), 2. 12-2. 25 (2H, m), 2. 37-2. 46 (2H, m), 3. 98 (1H, d, J=10. 3 Hz), 4. 10 (1H, d, J=10. 3Hz), 7. 52 (1H, s)。
 実施例45

3-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イル) プロピオン酸の製造

実施例44で製造した3-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イル)プロピオン酸 tertーブチルエステル(0.72g、2.42ミリモル)の塩化メチレン(14m1)溶液にトリフルオロ酢酸(2m1)を加え、更に30分間室温で攪拌した。反応液を減圧濃縮し、エタノールと塩化メチレンで結晶化し、微黄色固体の3-(2-メチルー6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イル)プロピオン酸(0.30g、51%)を得た。

- 10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δppm:
 1. 32 (3H, s), 1. 91-2. 09 (1H, m), 2. 12-2. 26 (1H, m), 2. 41-2. 74 (2H, m), 3. 89 (2H, s), 7. 96 (1H, s), 12. 19 (1H, br)。
 実施例46
- 15 2-(2-メチル-6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2-イルメトキシ)ベンゾオキサゾールの製造

実施例33で製造した2ーヒドロキシメチルー2ーメチルー6ーニトロー2, 3ージヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (0.32g、1.6ミリモル)のDMF (3m1)溶液に氷冷攪拌下、水素化ナトリウム (77mg、1.

- 20 9ミリモル)を加え、更に0℃で30分間攪拌した。反応液に氷冷攪拌下、2-クロロベンゾオキサゾール (0.30g、1.9ミリモル)のDMF (3m1) 溶液を加え、更に室温で44時間攪拌した。反応液に氷水を加え、酢酸エチルで 抽出し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカ ゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=100/1)によ
- 25 り精製し、アセトニトリル及びイソプロパノールで再結晶し、微黄色固体の 2-(2-x+) (2-x+) (3-x+) (2-x+) (3-x+) (2-x+) を得た。 融点 (2-x+) (2-x+) (2-x+) を得た。

実施例47

(R) -2-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメトキシ) ベンゾオキサゾールの製造

実施例 37で製造した(R) -2-ヒドロキシメチル-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール(0.40g、2.

5 0ミリモル)のDMF(4m1)溶液に氷冷攪拌下、水素化ナトリウム(0.1g、2.4ミリモル)を加え、0℃で30分間攪拌した。反応液に氷冷攪拌下、2ークロロベンゾオキサゾール(0.38g、2.4ミリモル)のDMF(4m1)溶液を加え、更に室温で48時間攪拌した。反応液に氷水を加え、析出物を濾取し、水で洗浄した。アセトニトリル及びイソプロパノールで再結晶し、微

10 黄色固体の(R) -2-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメトキシ) ベンゾオキサゾール (0.1 5 g、収率 2 4 %) を得た。

融点 232-233℃

光学純度 > 99.5% e e

15 [α]_D²⁶=+11.20°(濃度:0.518, DMSO)。 実施例48

2-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチルチオ) ベンゾオキサゾールの製造

2ーメルカプトベンゾオキサゾール(200mg、1.3ミリモル)及びDM F (3ml)の混合物に水素化ナトリウム(50mg、1.25ミリモル)を加え、室温下にて1時間撹拌した。次に、この反応液に、実施例41で製造したメタンスルホン酸2ーメチルー6ーニトロー2,3ージヒドロイミダゾ[2,1ーb]オキサゾールー2ーイルメチルエステル(330mg、1.2ミリモル)を加え、60-70℃にて5時間撹拌した。反応液を室温に戻し、水を加え、酢酸 エチルにより2回抽出した。有機相を合わせ、5%苛性ソーダにより洗浄し、3回水洗し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(nーヘキサン/酢酸エチル=1/1)にて精製し、白色粉末の2-(2ーメチルー6ーニトロー2,3ージヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールー2ーイルメチルチオ)ベンゾオキ

サゾール (37mg、収率9%) を得た。

融点 163-166℃。

実施例 4 9

2- [2-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-

b] オキサゾール-2-イル) エチルチオ] ベンゾオキサゾールの製造

実施例 42で製造したメタンスルホン酸 2-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ <math>[2, 1-b] オキサゾールー2-イル) エチルエステル $(300\,\mathrm{mg}\,, 1$ ミリモル)を用い、実施例 48と同様の方法により、白色粉末 結晶の 2-[2-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ <math>[2, 2]

10 1-b] オキサゾール-2-イル) エチルチオ] ベンゾオキサゾール (296 mg、収率83%) を得た。

融点 174-175℃。

実施例50

1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-3-

15 (1-フェニルー1H-テトラゾールー5-イルチオ)プロパンー2-オールの 製造

- 20 8.53ミリモル)及びエタノール(20ml)の混合物を終夜加熱還流した。 反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に水を加え、酢酸エチルにより 2回抽出した。有機相を合わせ、飽和重曹水により2回洗浄後、水、飽和食塩水 の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて 濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノ
- 25 ール=50/1)により精製し、微黄色粉末の $1-(2-\rho uu-4-z)$ レロイ ミダゾール-1ーイル)-2ーメチル-3--(1-フェニル-1H-テトラゾール-5-イルチオ)プロパン<math>-2-オール(2.1g、収率69%)を得た。 $^{1}H-NMR$ (CDC1g) δ ppm:

1. 38 (3H, s), 3. 54 (1H, d, J=14.8Hz), 3. 62

(1H, d, J=14.8Hz), 4.19(2H, s), 4.58(1H, s), 7.50-7.67(5H, m), 8.08(1H, s)。 実施例51

2-メチルー6-ニトロー2- (1-フェニルー1H-テトラゾールー5-イル ^{*} チオメチル) - 2、3 - ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾールの製造 実施例50で製造した1-(2-クロロー4-ニトロイミダゾールー1-イ ル) -2-メチル-3-(1-フェニル-1H-テトラゾール-5-イルチオ) プロパン-2-オール(2.1g、5.3ミリモル)及び1,4ージオキサン (40ml)の混合物に水素化ナトリウム(220mg、5.5ミリモル)を加 え、24時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に 10 水を加え、酢酸エチルにより2回抽出した。有機相を合わせ、水、飽和食塩水の 順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃 縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチ ル=1/1)により精製し、淡茶粉末の2-メチルー6-ニトロー2-(1-フ ェニルー1H-テトラゾールー5-イルチオメチル)-2,3-ジヒドロイミダ 15 ゾ [2, 1-b] オキサゾール (500mg、26%) を得た。 融点 140-147℃。

実施例52

(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾ 20 -ル-2-イルメトキシカルボニルアミノ)酢酸 t e r t-ブチルエステルの製 造

トリホスゲン (0.30g、0.76ミリモル)の塩化メチレン (10ml)溶液に氷冷攪拌下、グリシンtertーブチルエステル塩酸塩 (0.52g、2.27ミリモル)の塩化メチレン (5ml)溶液及びNーエチルジイソプロピルア 5 に (1.05ml,4.53ミリモル)を加え、更に室温で2時間攪拌した。不溶物を濾過して除き、濾液を減圧濃縮した。これを実施例33で製造した2ーヒドロキシメチルー2ーメチルー6ーニトロー2,3ージヒドロイミダブ [2,1-b]オキサゾール (0.30g、1.51ミリモル)のDMF (3ml)溶液に氷冷攪拌下加え、更に塩化第一銅 (75mg,0.76ミリモル)を加え、

更に室温で22時間攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(nーヘキサン/酢酸エチル=3/2)により精製し、白色固体の(2ーメチルー6ーニトロー2、3ージヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾールー2ーイルメトキシカルボニルアミノ)酢酸 tertーブチルエステル(40mg、収率7%)を得た。

融点 104-106℃。

実施例53

(4ーモルホリノフェニル)カルバミン酸6ーニトロー2,3ージヒドロイミダ
 10 ブ[2,1-b]オキサゾールー2ーイルメチルエステルの製造
 4ーモルホリノアニリン(0.40g、2.24ミリモル)のTHF(4
 m1)溶液に氷冷攪拌下,1,1'ーカルボニルジイミダゾール(0.44g、2.69ミリモル)を加え、0℃で2時間攪拌した。反応混合物を濾過し、ジェチルエーテルで洗浄した。濾液を実施例32で製造した2ーヒドロキシメチルー
 15 6ーニトロー2,3ージヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(0.30g、1.62ミリモル)のDMF(3m1)溶液に氷冷攪拌下加え,更に塩化銅(75mg、0.76ミリモル)を加え、更に室温で2時間攪拌した。反応液に

20 $\nu = 9/1$)により精製し、塩化メチレン及び酢酸エチルで洗浄し、白色固体の (4-モルホリノフェニル) カルバミン酸 6-ニトロ-2, $3-ジヒドロイミダ ブ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチルエステル <math>(34 \, \mathrm{mg} \, \mathrm{vms} \, 5$ %)を得た。

水を加え、酢酸エチルで抽出し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧

濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/アセト

 1 H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

25 2.93-3.09(4H, m), 3.64-3.80(4H, m), 4.13 (1H, dd, J=6.8Hz, 10.9Hz), 4.34-4.55(3H, m), 5.55-5.73(1H, m), 6.77-6.95(2H, m), 7. 18-7.41(2H, m), 8.15(1H, s), 9.52(1H, br)。 実施例54 4-クロロフェニルカルバミン酸 2- (6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2-イル)エチルエステルの製造

実施例 31で製造した 2-ヒドロキシエチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (0.2g, 1.0ミリモル) のDMF

- 5 (5m1)溶液に氷冷攪拌下、4ークロロフェニルイソシアネート(169ml、1.1ミリモル)及び塩化銅(50mg,0.5ミリモル)を加え、室温で4時間攪拌した。氷冷し、10%塩酸を加え、酢酸エチルで抽出し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=100/1)により精製し、塩化メチレン
- 10 及びジイソプロピルエーテルで結晶化し、白色固体の4-クロロフェニルカルバミン酸2-(6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b]オキサゾール-2-イル)エチルエステル (0.16g、収率45%)を得た。

 1 H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

2. 16-2. 38 (2H, m), 4. 08 (1H, dd, J=7. 4Hz, 1 0. 6Hz), 4. 16-4. 36 (2H, m), 4. 47 (1H, dd, J=7. 4Hz, 10. 6Hz), 5. 44-5. 55 (1H, m), 7. 30-7.

36 (2H, m), 7.46-7.52 (2H, m), 8.14 (1H, s),

9.83 (1H, br)。

15

フェニルイソシアネートと2ーヒドロキシエチルー2ーメチルー6ーニトロー202,3ージヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール、2ーエチルー2ーヒドロキシメチルー6ーニトロー2,3ージヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール又は2ーヒドロキシメチルー2ーイソプロピルー6ーニトロー2,3ージヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールを用い、実施例54と同様にして、実施例55〜実施例57の化合物を製造した。また2ーヒドロキシメチルー2ーメチルー6ーニトロー2,3ージヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールと3ーフルオロフェニルイソシアネート又は4ーtertーブトキシカルボニルフェニルイソシアネートを用い、実施例54と同様にして、実施例58及び実施例59の化合物を製造した。

実施例55

フェニルカルバミン酸 2 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 , 3 - ジヒドロイミダ ゾ [2 , 1 - b] オキサゾール - 2 - イル)エチルエステル

黄色固体、収率17%

 1 H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

- 5 1.63 (3H, s), 2.30 (2H, t, J=6.9Hz), 4.13 (1H, d, J=10.9Hz), 4.21-4.32 (3H, m), 6.96-7.02 (1H, m), 7.24-7.27 (2H, m), 7.43-7.46 (2H, m), 8.12 (1H, s), 9.60 (1H, br)。 実施例 56
- 10 フェニルカルバミン酸 2 ーエチルー 6 ーニトロー 2 , 3 ージヒドロイミダゾ [2, 1 ー b] オキサゾールー 2 ーイルメチルエステル

白色固体、収率60%

 1 H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

0. 93 (3H, t, J = 7.4 Hz), 1. 89-2. 11 (2H, m), 4.

15 19-4. 29 (2H, m), 4. 39-4. 50 (2H, m), 6. 99 (1 H, t, J=7. 2Hz), 7. 23-7. 29 (2H, m), 7. 34-7. 55 (2H, m), 8. 14 (1H, s), 9. 70 (1H, br)。 実施例57

フェニルカルバミン酸2ーイソプロピルー6-ニトロー2,3-ジヒドロイミダ

20 ゾ[2,1-b]オキサゾールー2ーイルメチルエステル

白色固体、収率73%

 1 H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

0. 97 (6H, dd, J=2. 7Hz, 6. 9Hz), 2. 25-2, 39 (1H, m), 4. 20 (1H, d, J=11. 4Hz), 4. 30 (1H, d,

25 J=11. 4Hz), 4. 48 (2H, s), 6. 99 (1H, t, J=7. 1 Hz), 7. 23-7. 29 (2H, m), 7. 32-7. 52 (2H, m), 8. 13 (1H, s), 9. 67 (1H, br).

実施例 5 8

3-フルオロフェニルカルバミン酸2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロ

イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステル 白色固体、収率71%

融点 168-169℃。

実施例59

5 4-(2-メチル-6-ニトロー2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキ サゾールー2-イルメトキシカルボニルアミノ)安息香酸tertーブチルエス テル

白色固体、収率32%

融点 177-178℃。

10 実施例60

4- (2-メチル-6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメトキシカルボニルアミノ) 安息香酸の製造

実施例59で製造した4ー(2ーメチルー6ーニトロー2、3ージヒドロイミ

20 オキサゾールー2-イルメトキシカルボニルアミノ)安息香酸を(50mg、収率31%)得た。

融点 248℃(分解)。

実施例61

4 ークロロフェニルカルバミン酸 2 ーメチルー 6 ーニトロー 2, 3 ージヒドロイ 25 ミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー 2 ーイルメチルエステルの製造

 ル (2m1) を加え、6時間加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、水を加え、酢酸エチルで抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。塩化メチレン及びジエチルエーテルで結晶化させ、微灰色固体の4-クロロフェニルカルバミン酸2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステル (0.17g, 収率22%) を得た。

融点 179-181℃。

実施例62

10 ルの製造

N- (4-クロロフェニル) -N-メチルカルバミン酸2-メチル-2-オキシラニルメチルエステル(1.7g、6.6ミリモル)及び2-クロロー4-ニトロー1H-イミダゾール(0.98g、6.6ミリモル)をエタノール(10m1)に懸濁し、酢酸ナトリウム(0.85g、10ミリモル)を加え、4時間1 加熱還流した。エタノールを減圧留去し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、塩化メチレンで抽出した。抽出液を硫酸マグネシムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=9/1)により精製し、微黄色油状物のN-(4-クロロフェニル)-N-メチルカルバミン酸3-(2-クロロー4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシー2-メチルプロピルエステル(2.7g、定量的)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 15 (3H, br), 3. 28 (3H, s), 3. 78-4. 28 (4H, m), 7. 11-7. 24 (2H, m), 7. 30-7. 41 (2H, m), 7. 90 (1H, br).

25 実施例 6 3

実施例62で製造したN-(4-クロロフェニル)-N-メチルカルバミン酸

3-(2-クロロー4-ニトロイミダゾールー1イル)-2-ヒドロキシー2-メチルプロピルエステル(2.7g、6.6ミリモル)の1,4-ジオキサン(30ml)溶液に氷冷攪拌下、水素化ナトリウム(0.32g、7.9ミリモル)を加え、12時間加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、氷冷して水を加え、

塩化メチレンで抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル)により精製し、塩化メチレンとエタノールで結晶化し、白色固体のNー(4ークロロフェニル)ーNーメチルカルバミン酸2ーメチルー6ーニトロー2、3ージヒドロイミダゾ [2, 1-b]オキサゾールー2ーイルメチルエステル(0.88g、収率36%)を得た。

10 融点 146-148℃。

実施例64

(R) -4-クロロフェニルカルバミン酸3-(2-クロロー4-ニトロイミダ ゾール-1-イル) -2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステルの製造

実施例10で製造した(R)-2-クロロ-1-(2, 3-ジヒドロキシ-2

- 15 ーメチルプロピル) -4-ニトロイミダゾール (1.5g、6.5ミリモル) の THF (30ml) 懸濁液に4ークロロフェニルイソシアネート (1.3g、8.5ミリモル) のTHF (15ml) 溶液及びトリエチルアミン (0.1ml) を 加え、更に室温で19時間攪拌した。不溶物を濾去し、濾液を減圧濃縮し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=9/1) により
- 20 精製し、白色固体の(R) -4-クロロフェニルカルバミン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル(2.1g、収率83%)を得た。

 $^{1}H-NMR$ (DMSO-d₆) δ ppm:

1. 15 (3H, s), 3. 99 (2H, s), 4. 07 (2H, s), 7. 2 25 9-7. 39 (2H, m), 7. 45-7. 58 (2H, m), 8. 33 (1H, s), 9. 86 (1H, br).

種々の対応するフェニルイソシアナート化合物を用い、実施例64と同様にして、実施例65~実施例69の化合物を製造した。またベンジルイソシアナートまたはメチルイソシアナートを用い、実施例64と同様にして、実施例70及び

実施例71の化合物を製造した。

実施例 6 5

- (R) -3-クロロフェニルカルバミン酸3-(2-クロロー4-ニトロイミダ ゾール-1-イル) -2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル
- 5 収率41%

¹H-NMR (DMSO-d₆) δppm:

1. 15 (3H, s), 4. 00 (2H, s), 4. 13 (2H, s), 5. 4 1 (1H, s), 7. 04-7. 09 (1H, m), 7. 29-7. 41 (2H,

m), 7. 55-7. 66 (1H, m), 8. 33 (1H, s), 9. 93 (1

10 H, br).

実施例66

(R) -4-ブロモフェニルカルバミン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダ ゾール-1-イル) -2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル 収率62%

15 1 H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

1. 15 (3H, s), 3. 99 (2H, s), 4. 13 (2H, s), 5. 4
0 (1H, s), 7. 34-7. 53 (4H, m), 8. 33 (1H, s), 9.
86 (1H, br)

実施例67

20 (R) -4-トリフルオロメチルフェニルカルバミン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステ ル

収率83%

 1 H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

25 1. 16 (3H, s), 4. 02 (2H, s), 4. 14 (2H, s), 5. 4 2 (1H, s), 7. 58-7. 74 (4H, m), 8. 34 (1H, s), 1 0. 14 (1H, br).

実施例68

(R) -4-トリフルオロメトキシフェニルカルバミン酸3-(2-クロロ-4

ーニトロイミダゾールー1ーイル) -2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエス テル

収率58%

 $^{1}H-NMR$ (DMSO-d₆) δ ppm:

5 1. 15 (3H, s), 3. 99 (2H, s), 4. 13 (2H, s), 5. 4 1 (1H, s), 7. 31 (2H, d, J=8. 5Hz), 7. 58 (2H, d, J=8. 5Hz), 8. 33 (1H, s), 9. 92 (1H, br).

実施例69

- (R) -4-フルオロフェニルカルバミン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミ
- 10 ダゾールー1ーイル) -2-ヒドロキシー2ーメチルプロピルエステル 収率95%

 $^{1}H-NMR$ (DMSO-d₆) δ ppm:

- 1. 15 (3H, s), 3. 98 (2H, s), 4. 12 (2H, s), 5. 3
- 9 (1H, s), 7. 10-7. 17 (2H, m), 7. 45-7. 51 (2H,
- 15 m), 8, 33 (1H, s), 9, 73 (1H, br).

実施例70

(R) ーベンジルカルバミン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1 -イル) -2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル

収率72%

- $20^{-1}H-NMR$ (CDCl₃) δ ppm:
 - 1. 20 (3H, s), 3. 61 (1H, br), 3. 97-4. 04 (3H,
 - m), 4. 23 (1H, d, J=12.0Hz), 4. 70-4.89 (1H,
 - m), 7. 13-7. 39 (5H, m), 8. 01 (1H, s).

実施例71

25 (R) ーメチルカルバミン酸3-(2-クロロー4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル · 収率73%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 21 (3H, s), 2. 80 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 57 (1

H, br), 3. 98-4. 16 (3H, m), 4. 24 (1H, d, J=12. 3Hz), 4. 72-4. 91 (1H, m), 8. 03 (1H, s)。 実施例72

(R) -N-メチル-N-(4ートリフルオロメトキシベンジル)カルバミン酸3-(2-クロロー4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステルの製造

N-メチル-N-(4-トリフルオロメトキシベンジル) カルバミルクロリド

(2.05g、7.65ミリモル)のトルエン(40ml) 懸濁液に実施例10で製造した(R)-2-クロロー1-(2,3-ジヒドロキシー2-メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾール(2.16g、9.18ミリモル)、N-エチルジイソプロピルアミン(2.67ml、15.30ミリモル)及び4-ジメチルアミノピリジン(0.19g、1.53ミリモル)を加え、100℃で3.5時間攪拌した。反応液を酢酸エチルで希釈し、10%塩酸で洗浄し、硫酸マグネ

シウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー

15 (塩化メチレン/酢酸エチル=9/1)により精製し、無色油状物の(R)-N-メチル-N-(4-トリフルオロメトキシベンジル)カルバミン酸3-(2-クロロー4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシー2-メチルプロピルエステル(2.74g、収率77%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

20 1. 25 (3H, s), 2. 83 (3H, s), 3. 87-4. 17 (4H, m), 4. 44 (2H, s), 7. 18-7. 25 (4H, m), 8. 05 (1 H, s).

実施例73

(R) -N-メチル-N-(4-トリフルオロメトキシベンジル)カルバミン酸 2-メチル-6-ニトロ-2、3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾー n-2-イルメチルエステルの製造

実施例72で製造した (R) -N-メチル-N- (4-トリフルオロメトキシベンジル) カルバミン酸3- (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル (2.74g、5.87ミ

リモル)のDMF(20m1)溶液に氷冷攪拌下、水素化ナトリウム(0.28g、7.04ミリモル)を加え、更に0℃で1時間攪拌した。反応液に氷水を加え、析出物を濾取し、水で洗浄した。イソプロパノールで再結晶し、白色固体の(R) -N-メチル-N-(4-トリフルオロメトキシベンジル)カルバミン酸2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステル(1.40g、収率55%)を得た。融点 123-124℃。

実施例74

- (R) -N-(4-クロロフェニル)-N-シクロヘキシルカルバミン酸3-
- 10 (2-クロロー4ーニトロイミダゾールー1ーイル) -2-ヒドロキシー2-メ チルプロピルエステルの製造

N- $(4-\rho \Box \Box \Box z = \lambda)$ -N-シクロヘキシルカルバモイルクロリド (1.56g, 6.05ミリモル)のトルエン(10m1)懸濁液に実施例10で製造した (R) -2-クロロ-1- (2,3-ジヒドロキシ-2-メチルプロピル)

- 15 -4-ニトロイミダゾール(0.95g、4.03ミリモル)、Nーエチルジイソプロピルアミン(1.45ml,8.06ミリモル)及び4ージメチルアミノピリジン(0.10g,0.81ミリモル)を加え、100℃で3時間攪拌した。反応液を酢酸エチルで希釈し、10%塩酸で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢
- 20 酸エチル=9/1)により精製し、白色アモルファスの(R)-N-(4-2)ロフェニル)-N-シクロヘキシルカルバミン酸3-(2-2)0ロロー4-21ロイミダゾール-1-41ル)-2-21にロキシー2-32のよチルプロピルエステル(O.75g、収率409%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

25 0. 78-1. 22 (6H, m), 1. 24-1. 48 (2H, m), 1. 54
-1. 67 (1H, m), 1. 70-1. 93 (4H, m), 2. 87-3. 1
3 (1H, m), 3. 72-3. 98 (3H, m), 4. 00-4. 24 (2H, m), 7. 00-7. 06 (2H, m), 7. 35-7. 41 (2H, m), 7. 80 (1H, br).

実施例75

- 実施例74で製造した(R)-N-(4-クロロフェニル)-N-シクロへキシルカルバミン酸3-(2-クロロー4-ニトロイミダゾールー1ーイル)-2ーヒドロキシー2ーメチルプロピルエステル(0.75g、1.59ミリモル)のDMF(7m1)溶液に氷冷攪拌下、水素化ナトリウム(76mg、1.91ミリモル)を加え、更に0℃で0.5時間攪拌した。反応液に氷水を加え、酢酸エチルで抽出し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をイソプロパノールで再結晶し、白色固体の(R)-N-(4-クロロフェニル)-N-シクロヘキシルカルバミン酸2-メチルー6-ニトロー2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールー2ーイルメチルエステル(0.53g、収率77%)を得た。
- 15 融点 175-177℃。

実施例76

- (R) -N-メチル-N-(4-トリフルオロメトキシフェニル) カルバミン酸 <math>3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-ヒドロキシ-2 -メチルプロピルエステルの製造
- 実施例10で製造した(R)-2-クロロー1-(2,3-ジヒドロキシー2ーメチル)プロピルー4-ニトロイミダゾール(0.82g、3.48ミリモル)のトルエン(10ml)懸濁液にN-メチルーN-(4-トリフルオロメトキシフェニル)カルバモイルクロリド(1.33g、5.23ミリモル)、N-エチルジイソプロピルアミン(1.2ml、6.97ミリモル)及び4-ジメチルアミノピリジン(85mg、0.70ミリモル)を加え、100℃で5時間攪拌した。反応液を酢酸エチルで希釈し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=2/1)により精製し、微黄色アモルファスの(R)-N-メチルーN-(4-トリフルオロメトキシフェニル)カルバミン酸3-(2-クロロ-4

ーニトロイミダゾールー1ーイル) -2-ヒドロキシー2-メチルプロピルエステル (1.04g、収率65%) を得た。

 $^{1}H-NMR$ (DMSO-d₆) δ ppm:

1. 02 (3H, s), 3. 26 (3H, s), 3. 80-4. 00 (4H,

5 m), 5. 39 (1H, s), 7. 37-7. 40 (2H, m), 7. 47-7. 52 (2H, m), 8. 25 (1H, s).

実施例 7 7

(R) - N - メチル - N - (4 - トリフルオロメトキシフェニル) カルバミン酸 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ <math>[2, 1 - b] オキサゾー

10 ルー2ーイルメチルエステルの製造

実施例 7 6 で製造した (R) -N-メチル-N- (4 - トリフルオロメトキシフェニル) カルバミン酸 3 - (2 - クロロー4 - ニトロイミダゾールー1 - イル) - 2 - ヒドロキシー2 - メチルプロピルエステル (4.50g、9.94ミリモル) のDMF (13.5 ml) 溶液に氷冷攪拌下、水素化ナトリウム (0.

15 48g、11.9ミリモル)を加え、室温で1時間攪拌した。反応混合液に水及び酢酸エチルを加えて析出物を濾取した。粗結晶をイソプロパノールから再結晶し、微黄色固体の(R)-NーメチルーNー(4ートリフルオロメトキシフェニル)カルバミン酸2-メチルー6-ニトロー2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールー2-イルメチルエステル(2.95g、収率71%)を得

20 た。

融点 144-145℃

光学純度 99.8%ee

 $[\alpha]$ D 2 4 = 7. 68° (濃度: 0. 938, CHCl3)。

対応する出発原料を用い、実施例77と同様にして、実施例78及び実施例7 25 9の化合物を製造した。

実施例78

(R) -メチルカルバミン酸 2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダ $\sqrt[3]{2}$ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステル 収率 2.6 %、融点 1.75-1.78 %。

実施例79

(R) -ジエチルカルバミン酸 2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステル収率 $2\,$ 7%、融点 $1\,$ 96-19 $\,$ 7 \mathbb{C}_{o}

5 実施例80

実施例64で製造した(R) -4-クロロフェニルカルバミン酸3-(2-クロロー4ーニトロイミダゾールー1ーイル) -2-ヒドロキシー2ーメチルプロピルエステル(1.5g、3.8ミリモル)のDMSO(40m1)溶液にヨードメタン(0.71m1、11.4ミリモル)及び水酸化カリウム(0,64g、11.4ミリモル)を加え、室温で4時間攪拌した。氷冷して10%塩酸を加え、酢酸エチルで抽出し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。

- 残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=1/1)により精製し、イソプロパノールで再結晶し、白色固体の(R)-N-(4-クロロフェニル)-N-メチルカルバミン酸2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチルエステル(0.67g、収率60%)を得た。
- 20 融点 131-133℃

光学純度 99.8%ee

 $\left[\alpha\right]_{D}^{26} = 22.86^{\circ}$ (濃度: 1.028, CHCl $_{3}$)。 実施例81

(R) ービス(4ークロロフェニル)カルバミン酸2ーメチルー6ーニトロー2,25 3ージヒドロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾールー2ーイルメチルエステルの製造

実施例 37で製造した (R) -2-ヒドロキシメチル-2-メチル-6-ニトロ-2、3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (0.30g、1.5ミリモル)の塩化メチレン (15m1) 懸濁液に氷冷攪拌下、ピリジン (0.5)

37ml、4.5ミリモル)及びトリホスゲン(0.16g、0.5ミリモル)を加え、更に室温で2.5時間攪拌した。反応液にビス(4ークロロフェニル)アミン(0.39g、1.6ミリモル)を加え、更に室温で20時間攪拌した。反応液を氷冷し、10%塩酸を加え、塩化メチレンで抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=19/1)により精製し、イソプロパノールで再結晶し、白色固体の(R)ービス(4ークロロフェニル)カルバミン酸2ーメチルー6ーニトロー2、3ージヒドロイミダゾ [2、1ーb] オキサゾールー2ーイルメチルエステル(82mg、収率12%)を得た。

10 融点 200-201℃。

実施例82

実施例33で製造した2-ヒドロキシメチルー2-メチルー6-ニトロー2,

- 15 3ージヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール(0.3g、1.5ミリモル)の塩化メチレン(15ml) 懸濁液に氷冷攪拌下、ピリジン(0.37ml、4.5ミリモル)及びトリホスゲン(0.18g、0.6ミリモル)を加え、更に室温で2時間攪拌した。反応液を氷冷し、ピペリジン(0.16ml、1.7ミリモル)を加え、更に室温で3時間攪拌した。反応液を氷冷し、10%塩酸を20 加え、不溶物を濾過して除き、塩化メチレンで洗浄した。濾液を分液し、有機相を硫酸マグネシムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-0キサン/酢酸エチル=3/2)により特製し、塩化メチレン及
 - ラフィー $(n-\wedge + + \nu)$ 酢酸エチル= 3/2)により精製し、塩化メチレン及びジイソプロピルエーテルで再結晶し、白色固体のピペリジン-1-カルボン酸 2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾー
- 25 ルー2-イルメチルエステル (65mg、収率14%) を得た。

融点 152-154℃。

実施例83

4- (4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペラジン-1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシー2-メ 5

チルプロピルエステルの製造

実施例 3 で製造した $2-\rho$ ロロー1ー(2、3ージヒドロキシー2ーメチルプロピル)ー4ーニトロイミダゾール(0.30g、1.3ミリモル)のトルエン(5 m l)懸濁液に 4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペラジンー1ーカルボニルクロリド(0.26g、0.85ミリモル)、Nーエチルジイソプロピルアミン(0.30 m l、1.7ミリモル)及び 4-ジメチルアミノピリジン(21 m g、0.17ミリモル)を加え、100で2.5時間攪拌した。酢酸エチルで希釈し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=9/

10 1)により精製し、微黄色油状物の4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペラジン-1-カルボン酸3-(2-クロロー4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル(0.24g、収率55%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

15 1. 26 (3H, s), 3. 02-3. 17 (4H, m), 3. 39-3. 72 (4H, m), 3. 91 (1H, s), 3. 99-4. 18 (3H, m), 4. 34 (1H, d, J=12. 3Hz), 6. 85-6. 98 (2H, m), 7. 09-7. 22 (2H, m), 8. 05 (1H, s)。 実施例84

20 4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペラジン-1-カルボン酸2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2 ーイルメチルエステルの製造

実施例83で製造した4-(4-トリフルオロメチトキシフェニル)ピペラジン-1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-

25 2ーヒドロキシー2ーメチルプロピルエステル (0.24g、0.47ミリモル)のDMF (2ml)溶液に氷冷攪拌下、水素化ナトリウム (23mg、0.56ミリモル)を加え、更に0℃で1時間攪拌した。反応液に氷水を加え、酢酸エチルで抽出し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル)により精製し、ジイソプ

ロピルエーテルで洗浄し、白色固体の4-(4-1)フルオロメトキシフェニル)ピペラジン-1-カルボン酸2-メチル6-ニトロ-2、3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステル (0. 13g、収率 5.8%)を得た。

5 融点 138-140℃。

実施例85

- 4-(4-)リフルオロメチルフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステルの製造
- 10 4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-カルボニルクロリド(0.10g、0.38ミリモル)のトルエン(3m1)懸濁液に、実施例3で製造した2-クロロ-1-(2,3-ジヒドロキシ-2-メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾール(0.13g、0.57ミリモル)、N-エチルジイソプロピルアミン(0.13m1、0.76ミリモ
- 15 ル)、4ージメチルアミノピリジン(10mg、0.08ミリモル)を加え、2.5時間100℃で攪拌した。反応液を酢酸エチルで希釈し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=9/1)により精製し、無色油状物の4ー(4ートリフルオロメチルフェニル)-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1
- 20 ーカルボン酸 $3-(2-\rho pp-4-k-pp-4-k-pp-1-k-pp-1-k-pp-1-k-pp-1-k-pp-2-k-pp$
 - 1. 26 (3H, s), 2. 43-2. 50 (2H, m), 3. 50-3. 78 (2H, m), 3. 93-4. 24 (5H, m), 7. 46 (1H, d, J=8.
- 25 3 H z), 7.60 (1 H, d, J=8.3 H z), 8.05 (1 H, s)。 実施例86
 - 4-(4-h) フルオロメチルフェニル)-1, 2, 3, 6-F トラヒドロピリジン-1-b ブンー1-b オキサゾール-2-1 イルメチルエステルの製造

実施例85で製造した4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル(0.11g、0.23ミリモル)のDMF(1m1)溶液に氷冷攪拌下、水素化ナトリウム(11mg、0.28ミリモル)を加え、更に0℃で1時間攪拌した。反応液に氷水を加え、酢酸エチルで抽出し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=4/1)により精製し、ジイソプロピルエーテルで洗浄し、白色固体の4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-カルボン酸2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチルエステル(0.04g、収率39%)を得た。

融点 113-115℃。

実施例87

15 (R) -4-tertーブトキシカルボニルピペラジン-1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-ヒドロキシ-2-メ チルプロピルエステルの製造

4-クロロカルボニルピペラジン-1-カルボン酸 t e r t - ブチルエステル (3.34g、13.42ミリモル)のトルエン (70ml) 懸濁液に実施例1 20 0で製造した(R)-2-クロロ-1-(2,3-ジヒドロキシ-2-メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾール(4.43g、18.79ミリモル)、N-エチルジイソプロピルアミン(4.68ml、26.84ミリモル)及び4-ジメチルアミノピリジン(0.33g、2.68ミリモル)を加え、100℃で4.5時間攪拌した。反応液を酢酸エチルで希釈し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/塩化メチレン/酢酸エチル=45/45/10)により精製し、無色油状物の(R)-4-tert-ブトキシカルボニルピペラジン-1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステルを(4.12g、収率69%)得た。

 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

- 1. 23 (3H, s), 1. 47 (9H, s), 3. 33-3. 50 (8H, m), 3. 91 (1H, s), 3. 99-4. 16 (3H, m), 4. 30 (1H, d, J=12. 1Hz), 8. 04 (1H, s).
- 5 4-(4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル)ピペラジン-1 ーカルボニルクロライドまたは4-[3-(4-トリフルオロメチルフェニル) -2-プロペニルオキシカルボニル]ピペラジン-1-カルボニルクロライドを 用い、実施例87と同様にして、実施例88及び実施例89の化合物を製造した。 実施例88
- 10 (R) -2-クロロ-1- {3-[4-(4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル) ピペラジン-1-イルカルボニルオキシ] -2-ヒドロキシー2-メチルプロピル} -4-ニトロイミダゾール収率81%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

- 15 1. 24 (3H, s), 3. 28-3. 61 (8H, m), 3. 89 (1H, s), 4. 00-4. 20 (3H, m), 4. 31 (1H, d, J=12. 5 Hz), 5. 14 (2H, s), 7. 22 (2H, d, J=8. 7Hz), 7. 39 (2H, d, J=8. 7Hz), 8. 04 (1H, s)。 実施例89
- 20 (R) -2-クロロ-1- {3-[4-[3-(4-トリフルオロメチルフェニル) -2-プロペニルカルボニル] ピペラジン-1-イルカルボニルオキシ] -2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル} -4-ニトロイミダゾール 収率95%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

25 1. 24 (3H, s), 3. 33-3. 61 (8H, m), 3. 90 (1H, s), 3. 99-4. 17 (3H, m), 4. 31 (1H, d, J=12. 1 Hz), 4. 79 (2H, d, J=6. 1Hz), 6. 39 (1H, dt, J=6. 1Hz, 15. 9Hz), 6. 67 (1H, d, J=15. 9Hz), 7. 39 (2H, d, J=8. 3Hz), 7. 49 (2H, d, J=8. 3Hz),

8. 04 (1H, s)

実施例90

(R) -4-(4-クロロベンジル)ピペラジン-1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロ

5 ピルエステルの製造

- 10 プロピルアミン(2.81ml、16.10ミリモル)及び4ージメチルアミノピリジン(0.20g、1.61ミリモル)を加え、3時間100℃で攪拌した。反応液を酢酸エチルで希釈し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=9/1)により精製し、黄色油状物の(R)-4-(4-2)ロロベンジル)
- 15 ピペラジン-1-カルボン酸3-(2-クロロー4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル(1.82g、収率48%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 23 (3H, s), 2. 17-2.50 (4H, m), 2. 55 (1H,

20 s), 3. 26-3. 52 (6H, m), 3. 98-4. 20 (3H, m), 4. 30 (1H, d, J=12. 4Hz), 7. 23-7. 32 (4H, m), 8. 05 (1H, s).

対応する出発原料を用い、実施例90と同様にして、実施例91及び実施例9 2の化合物を製造した。

25 実施例 9 1

(R) -2-クロロー1- {3-[4-(4-トリフルオロメチルベンジル)ピペラジン-1-イルカルボニルオキシ] -2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル} -4-ニトロイミダゾール 収率31% ¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

- 1. 23 (3H, s), 2. 24-2. 54 (4H, m), 3. 24-3. 50 (4H, m), 3. 56 (2H, s), 3. 97-4. 20 (3H, m), 4. 32 (1H, d, J=12.4Hz), 7. 45 (2H, d, J=8.0Hz),
- 5 7.58 (2H, d, J=8.0Hz), 8.05 (1H, s)。 実施例92
- 10 収率47%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

- 1. 23 (3H, s), 2. 22-2. 54 (4H, m), 3. 30-3. 54 (4H, m), 3. 50 (2H, s), 3. 97-4. 16 (3H, m), 4. 32 (1H, d, J=12. 5Hz), 7. 15-7. 18 (2H, m), 7.
- 15 32-7. 36 (2H, m), 8. 05 (1H, s).

実施例93

- (R) -4- (4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン-1-カルボン酸3- (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-ヒドロキシー2-メチルプロピルエステルの製造
- 20 実施例10で製造した(R)-2-クロロー1-(2,3-ジヒドロキシー2 ーメチルプロピル)-4-ニトロイミダゾール(0.65g、2.8ミリモル) のトルエン(13ml)懸濁液に4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペラジン-1-カルボニルクロリド(1.25g、4.2ミリモル)、Nーエチルジイソプロピルアミン(0.96ml,5.6ミリモル)及び4-ジメチルア
- 25 ミノピリジン (67mg、0.56ミリモル)を加え、100℃で8.5時間攪拌した。反応液を酢酸エチルで希釈し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=19/1)により精製し、黄色油状物の(R)-4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペラジン-1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニ

トロイミダゾールー1ーイル) -2ーヒドロキシー2ーメチルプロピルエステル (1.29g、収率92%) を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 26 (3H, s), 3. 02-3. 17 (4H, m), 3. 39-3. 72
5 (4H, m), 3. 91 (1H, s), 3. 99-4. 18 (3H, m), 4. 34 (1H, d, J=12. 3Hz), 6. 85-6. 98 (2H, m), 7. 09-7. 22 (2H, m), 8. 05 (1H, s).

対応する出発原料を用い、実施例93と同様にして、実施例94~実施例10 2の化合物を製造した。

10 実施例94

収率48%

- 15 ¹H-NMR (CDCl₃) δ p p m : 1. 26 (3H, s), 3. 13-3. 35 (4H, m), 3. 48-3. 72 (4H, m), 3. 94 (1H, s), 4. 00-4. 18 (3H, m), 4. 33 (1H, d, J=12. 3Hz), 6. 93 (2H, d, J=8. 6Hz), 7. 50 (2H, d, J=8. 6Hz), 8. 05 (1H, s).
- 20 実施例 9 5
 - $(R) 4 (4 \mathsf{y} \, \mathsf{h} + \mathsf{v} \, \mathsf{D} \, \mathsf{x} = \mathsf{L} \, \mathsf{h})$ ピペラジン $-1 \mathsf{d} \, \mathsf{L} \, \mathsf{L} \, \mathsf{m} \, \mathsf{d} \, \mathsf{d} = (2 \mathsf{d} \, \mathsf{L} \, \mathsf{$

収率54%

25 ¹H-NMR (CDCl₃) δ p p m: 1. 24 (3H, s), 2. 93-3. 09 (4H, m), 3. 52-3. 63 (4H, m), 3. 77 (3H, s), 3. 96 (1H, s), 4. 00-4. 19 (3H, m), 4. 32 (1H, d, J=12. 3Hz), 6. 82-6. 92 (4H, m), 8. 05 (1H, s). 実施例96

- (R) -4-(4-クロロフェニル) ピペラジン-1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル
- 5 収率81%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 25 (3H, s), 3. 00-3. 13 (4H, m), 3. 52-3. 65 (4H, m), 3. 93 (1H, s), 4. 00-4. 17 (3H, m), 4. 33 (1H, d, J=12. 5Hz), 6. 82-6. 86 (2H, m), 7.

 $10 \quad 20-7. \quad 25 \quad (2H, m), 8. \quad 05 \quad (1H, s)$

実施例97

- (R) -4-(3-クロロフェニル)ピペラジン-1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル
- 15 収率87%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 25 (3H, s), 3. 04-3. 22 (4H, m), 3. 43-3. 70 (4H, m), 3. 89 (1H, s), 4. 00-4. 17 (3H, m), 4. 33 (1H, d, J=12. 3Hz), 6. 78 (1H, ddd, J=1. 6

20 Hz, 2. 4Hz, 8. 4Hz), 6. 85-6. 88 (2H, m), 7. 19 (1H, t, J=8. 4Hz), 8. 05 (1H, s).

実施例98

- (R) -4-(3,4-ジクロロフェニル)ピペラジン-1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ビドロキシー2-メ
- 25 チルプロピルエステル

収率47%

 1 H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

1. 12 (3H, s), 3. 15-3. 26 (4H, m), 3. 39-3. 61 (4H, m), 3. 88 (1H, d, J=11.0Hz), 3. 93 (1H, d,

J=11.0Hz), 4.07 (1H, d, J=14.7Hz), 4.15 (1H, d, J=14.7Hz), 6.96 (1H, dd, J=2.9Hz, 9.1Hz), 7.16 (1H, d, J=2.9Hz), 7.42 (1H, d, J=9.1Hz), 8.34 (1H, s).

5 実施例99

(R) -4-(4-フルオロフェニル)ピペラジン-1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル

収率100%

- 10 ¹H-NMR (CDCl₃) δ p p m:
 1. 25 (3H, s), 2. 96-3. 09 (4H, m), 3. 50-3. 67 (4H, m), 3. 98 (1H, s), 4. 05-4. 16 (3H, m), 4. 33 (1H, d, J=12. 3Hz), 6. 85-7. 02 (4H, m), 8. 05 (1H, s).
- 15 実施例100
 - (R) -4-(3-トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン-1-カルボン酸 3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-ヒドロキシ-2 -メチルプロピルエステル

収率83%

- 20 ¹H-NMR (CDCl₃) δ p p m: 1. 25 (3H, s), 3. 11-3. 26 (4H, m), 3. 48-3. 70 (4H, m), 3. 91 (1H, s), 4. 00-4. 24 (3H, m), 4. 33 (1H, d, J=12. 3Hz), 7. 02-7. 20 (3H, m), 7. 38 (1H, t, J=8. 0Hz), 8. 05 (1H, s).
- 25 実施例101
 - (R) -2-クロロ-1-(3-ジエチルアミノカルボニルオキシ-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル) -4-ニトロイミダゾール

収率37%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

- 1. 11 (6H, t, J=7. 1Hz), 1. 20 (3H, s), 3. 16 (4H, q, J=7. 1Hz), 3. 76 (1H, br), 4. 06-4. 11 (3H, m), 4. 26 (1H, d, J=11. 1Hz), 8. 05 (1H, s)。 実施例102
- 5 2ークロロー1ー(3ーモルホリノカルボニルオキシー2ーヒドロキシー2ーメ チルプロピル)ー4ーニトロイミダゾール 収率100%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 23 (3H, s), 3. 35-3. 52 (4H, m), 3. 61-3. 72 10 (4H, m), 3. 99-4. 16 (3H, m), 4. 31 (1H, d, J=1 2. 3Hz), 8. 05 (1H, s).

実施例103

15

- (R) -4-(4-トリフルオロメチルベンジリデンアミノ) ピペラジン-1-カルボン酸 3-(2-クロロー4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステルの製造
- 4- (4-トリフルオロメチルベンジリデンアミノ) ピペラジン-1-カルボニルクロリド (2.48g、7.77ミリモル) のトルエン (40ml) 懸濁液に実施例10で製造した (R) -2-クロロ-1- (2,3-ジヒドロキシ-2-メチルプロピル) -4-ニトロイミダゾール (2.75g、11.66ミリモ
- 20 ル)、N-エチルジイソプロピルアミン(2.71ml、15.54ミリモル)及び4-ジメチルアミノピリジン(0.19g、1.55ミリモル)を加え、100℃で2.5時間攪拌した。反応液を酢酸エチルで希釈し、10%塩酸で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=9/1)により精製し、黄色油状物
- 25 の (R) -4-(4-)リフルオロメチルベンジリデンアミノ)ピペラジン-1 -カルボン酸3-(2-)クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒ ドロキシ-2-メチルプロピルエステル(4.03g、定量的)を得た。
 - ¹H-NMR (CDCl₃) δppm:
 - 1. 25 (3H, s), 3. 04-3.33 (4H, m), 3. 48-3.76

(4H, m), 3. 83 (1H, s), 4. 00-4. 17 (3H, m), 4. 33 (1H, d, J=12. 3Hz), 7. 55 (1H, s), 7. 59 (2H, d, J=8. 4Hz), 7. 69 (2H, d, J=8. 4Hz), 8. 04 (1H, s).

5 実施例104

4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジン-1-カルボニルクロリド(0.72g、2.34ミリモル)のトルエン(40ml) 懸濁液に、実施例10で製造した(R)-2-クロロ-1-(2,3-ジヒドロキシ-2-メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾール(1.16g、4.68ミリモル)とトリエチルアミン(1.63ml、11.70ミリモル)を加え、100℃で2.5時間攪拌した。反応液を酢酸エチルで希釈し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=9/1)により精製し、無色油状物の(R)-4-(4-

トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル(184 mg、収率16%)を得た。
20 1 H-NMR(CDC 1 $_{3}$) δ p p m:

H-NMR (CDC1₃) δ p p m:

1. 24 (3H, s), 1. 72-1. 98 (4H, m), 3. 33-3. 67 (4H, m), 3. 91-4. 20 (3H, m), 4. 24-4. 39 (1H, m), 4. 52-4. 65 (1H, m), 6. 96 (2H, d, J=8. 7 Hz), 7. 55 (2H, d, J=8. 7 Hz), 8. 05 (1H, s).

25 実施例105

(R) -4-(4-トリフルオロメチルフェニルアミノ)ピペリジン-1-カルボン酸 3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシー2-メチルプロピルエステルの製造

4- (4-トリフルオロメチルフェニルアミノ) ピペリジン-1-カルボニル

クロリド (1.43g、4.67ミリモル)のトルエン (30m1) 懸濁液に実施例10で製造した (R) -2-クロロー1-(2,3-ジヒドロキシ-2-メチルプロピル) -4-ニトロイミダゾール (1.54g、7.01ミリモル)、N-エチルジイソプロピルアミン (1.63m1,9.34ミリモル)、4-ジメチルアミノピリジン (0.11g、0.93ミリモル)を加え、100℃で2.5時間攪拌した。反応液を酢酸エチルで希釈し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=9/1)により精製し、微黄色油状物の (R) -4-(4ートリフルオロメチルフェニルアミノ)ピペリジン-1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプ

10 クロロー4ーニトロイミダゾールー1ーイル) -2-ヒドロキシー2-メチルプロピルエステルを (1.44g、収率61%) 得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 25 (3H, s), 1. 30-1. 48 (2H, m), 1. 98-2. 13 (2H, m), 2. 83-3. 13 (2H, m), 3. 37-3. 61 (1H,

15 m), 3. 83-3. 96 (2H, m), 3. 96-4. 22 (4H, m), 4.
34 (1H, d, J=11. 8Hz), 7. 40 (2H, d, J=8. 5Hz),
7. 60 (2H, d, J=8. 5Hz), 8. 07 (1H, s)。

実施例106

(R) -4-(4-トリフルオロメチルフェニル) -1, 2, 3, 6-テトラヒ
 20 ドロピリジン-1-カルボン酸3-(2-クロロー4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステルの製造

4-(4-h)フルオロメチルフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-カルボニルクロリド(0.60g、2.07ミリモル)のトルエン(36m1)懸濁液に、実施例10で製造した(R)<math>-2-クロロ-1-(2,

25 3ージヒドロキシー2ーメチル)プロピルー4ーニトロイミダゾール(0.74g、3.11ミリモル)及びトリエチルアミン(1.74ml、12.42ミリモル)を加え、100℃で16時間攪拌した。酢酸エチルで希釈し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=9/1)により精製し、微黄色油状物の

- (R) 4 (4-h) フルオロメチルフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1 ーカルボン酸 $3-(2-\rho$ ロロー4 ーニトロイミダゾール-1 ーイル)-2 ーヒドロキシ-2 ーメチルプロピルエステル(0. 32g、収率 31%)を得た。
- 5 ¹H-NMR (CDCl₃) δ p p m: 1. 26 (3H, s), 2. 43-2. 50 (2H, m), 3. 50-3. 78 (2H, m), 3. 93-4. 24 (5H, m), 7. 46 (2H, d, J=8. 3Hz), 7. 60 (2H, d, J=8. 3Hz), 8. 05 (1H, s)。

対応する出発原料を用い、実施例106と同様にして、実施例107~112 10 の化合物を製造した。

実施例107

- 15 収率94%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

- 1. 25 (3H, s), 2. 41-2. 59 (2H, m), 3. 50-3. 78 (2H, m), 3. 93-4. 22 (6H, m), 4. 35 (1H, d, J=1 2. 3Hz), 5. 87-6. 13 (1H, m), 7. 26-7. 37 (4H,
- 20 m), 8. 05 (1H, s).

実施例108

- (R) 4 (4 h) フルオロメトキシフェニル) 1, 2, 3, $6 \pi h$ ヒドロピリジン $1 \pi h$ カルボン酸 $3 (2 \pi h)$ ロロー $4 \pi h$ トロイミダゾールー $1 \pi h$ カーシーとドロキシー $2 \pi h$ チルプロピルエステル
- 25 収率92%

¹H-NMR (CDCl₃) δ p p m: 1. 26 (3H, s), 2. 46-2. 59 (2H, m), 3. 13-3. 37 (1H, m), 3. 50-3. 74 (2H, m), 4. 00-4. 14 (6H, m), 4. 36 (1H, d, J=12. 4Hz), 7. 19 (2H, d, J=8.

- OHz), 7. 37 (2H, d, J=8. OHz), 8. 05 (1H, s)。 実施例109
- (R) 4 (4 メトキシフェニル) 1, 2, 3, 6 テトラヒドロピリジンー1 カルボン酸3 (2 クロロー4 ニトロイミダゾールー1 イル) -
- 5 2-ヒドロキシー2-メチルプロピルエステル

収率63%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

- 1. 23 (3H, s), 2. 43-2. 61 (2H, m), 3. 52-3. 74 (2H, m), 3. 82 (3H, s), 4. 01-4. 16 (5H, m), 4.
- 10 34 (1H, d, J=12.6Hz), 5.83-6.00 (1H, m), 6.88 (2H, d, J=8.8Hz), 7.30 (2H, d, J=8.8Hz), 8.05 (1H, s).

実施例110

- (R) 4 (3 h) フルオロメチルフェニル) -1, 2, 3, 6 テトラヒ
- 15 ドロピリジンー1ーカルボン酸3ー(2ークロロー4ーニトロイミダゾールー1 ーイル) -2ーヒドロキシー2ーメチルプロピルエステル

収率54%

 $^{1}H-NMR$ (CDCl₃) δ ppm:

1. 25 (3H, s), 2. 46-2. 70 (2H, m), 3. 50-3. 78

20 (2H, m), 4. 00-4. 32 (6H, m), 4. 35 (1H, d, J=1

2. 6Hz), 5. 98-6. 22 (1H, m), 7. 39-7. 67 (4H, m), 8. 06 (1H, s).

実施例111

- (R) 4 (4 ブロモフェニル) 1, 2, 3, 6 テトラヒドロピリジン
- 25 -1-カルボン酸3-(2-クロロー4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2 -ヒドロキシー2-メチルプロピルエステル

収率80%

- ¹H-NMR (CDCl₃) δppm:
- 1. 25 (3H, s), 2. 41-2. 63 (2H, m), 3. 50-3. 76

収率57%

(2H, m), 3. 96-4. 20 (6H, m), 4. 35 (1H, d, J=1 2. 3Hz), 5. 87-6. 13 (1H, m), 7. 15-7. 26 (2H, m), 7. 43-7. 48 (2H, m), 8. 05 (1H, s)。 実施例112

5 (R) -4-(4-フルオロフェニル) -1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-カルボン酸3-(2-クロロー4-ニトロイミダゾールー1-イル) -2-ヒドロキシー2-メチルプロピルエステル

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

10 1. 25 (3H, s), 2. 41-2. 63 (2H, m), 3. 50-3. 76 (2H, m), 3. 89-4. 22 (6H, m), 4. 35 (1H, d, J=1 2. 6Hz), 5. 83-6. 04 (1H, m), 6. 99-7. 06 (2H, m), 7. 29-7. 35 (2H, m), 8. 05 (1H, s).

5-クロロー2, 3-ジヒドロインドールー1-カルボニルクロリド、5-ク

15 ロロー1,3-ジヒドロイソインドールー2ーカルボニルクロリド、6ークロロー3,4-ジヒドロー1H-イソキノリンー2ーカルボニルクロリド又は6ークロロー3,4-ジヒドロー2H-キノリンー1ーカルボニルクロリドを用い、実施例106と同様にして、実施例113~実施例116の化合物を製造した。

実施例113

20 (R) -5-クロロインドリニル-1-カルボン酸 3- (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル 微黄色アモルファス、収率 50%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 27 (3H, s), 3. 14 (2H, t, J=8.5Hz), 3. 42 (1)

25 H, br), 3. 91-4. 28 (5H, m), 4. 37 (1H, d, J=11. 8Hz), 7. 04-7. 24 (2H, m), 7. 73 (1H, d, J=8. 3 Hz), 8. 04 (1H, s)

実施例114

(R) -5-クロロイソインドリニル-2-カルボン酸3-(2-クロロ-4-

ニトロイミダゾールー1ーイル) -2-ヒドロキシー2-メチルプロピルエステル

茶色固体、収率19%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

5 1. 27 (3H, s), 3. 93 (1H, d, J=7. 8Hz), 4. 04-4. 24 (7H, m), 4. 32 (1H, d, J=11. 8Hz), 7. 16-7. 29 (3H, m), 8. 07 (1H, s).

実施例115

(R) - 6 - 0 ロロー3, 4 - ジヒドロー1 H - イソキノリンー2 - カルボン酸

10 3-(2-クロロー4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2 -メチルプロピルエステル

微黄色油状物、収率63%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 24 (3H, s), 2. 83 (2H, t, J=5. 8Hz), 3. 46-3.

15 76 (2H, m), 3. 90 (1H, d, J=5. 3Hz), 4. 01-4. 1 5 (3H, m), 4. 34 (1H, d, J=12. 3Hz), 4. 43-4. 6 5 (2H, m), 6. 93-7. 09 (1H, m), 7. 09-7. 22 (2H, m), 8. 04 (1H, s).

実施例116

微黄色油状物、収率70%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

25 1. 26 (3H, s), 1. 87-2. 00 (2H, m), 2. 76 (2H, t, J=6. 5Hz), 3. 27 (1H, br), 3. 57-3. 83 (2H, m), 3. 98-4. 17 (3H, m), 4. 33 (1H, d, J=12. 0Hz), 7. 12-7. 16 (2H, m), 7. 41-7. 61 (1H, br), 7. 9 8 (1H, s).

実施例117

- (R) -4-tert-ブトキシカルボニルピペラジン-1-カルボン酸2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステルの製造
- 実施例87で製造した(R) -4-tert-ブトキシカルボニルピペラジン -1-カルボン酸3-(2-クロロー4-ニトロイミダゾールー1ーイル)-2 -ヒドロキシー2-メチルプロピルエステル(4.12g、9.20ミリモル) のDMF(30ml)溶液に氷冷攪拌下、水素化ナトリウム(0.44g、11.04ミリモル)を加え、0℃で1時間撹拌した。反応液に氷水を加え、析出物を 1 濾取し、粗結晶をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(麻酔エチル)によります。
- 10 濾取し、粗結晶をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル)により精製し、イソプロパノールで洗浄し、白色固体の(R)-4-tertーブトキシカルボニルピペラジン-1-カルボン酸2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチルエステル(2.24g、収率59%)を得た。
- 15 融点 211-212℃。

実施例118

- (R) -4-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジンー<math>1-カルボン酸 2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステルの製造
- 20 実施例93で製造した(R) -4-(4-トリフルオロメチトキシフェニル) ピペラジン-1-カルボン酸3-(2-クロロー4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル(1.29g、2.5ミリモル)のDMF(13m1)溶液に氷冷撹拌下、水素化ナトリウム(0.12g、3ミリモル)を加え、更に0℃で1時間撹拌した。反応液に氷水を加え、析
- 25 出物を濾取し、水で洗浄し、イソプロパノールから再結晶し、白色固体の (R) -4-(4-) トキシフェニル) ピペラジン-1- カルボン酸 2- メチル-6- ニトロ-2 、3- ジヒドロイミダゾ [2 、1- b] オキサゾール- 2- イルメチルエステルを (0.70g 、収率 59% 得た。

光学純度 99.6% e e

[α]_D²⁵=0.99°(濃度:0.704, CHCl₃) 融点 168-169℃。

実施例119

(R) -4-(4-クロロベンジル)ピペラジン-1-カルボン酸2-メチル65 -ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾールー2ーイルメチルエステルの製造

実施例90で製造した(R)-4-(4-クロロベンジル)ピペラジン-1-

15 46g、収率28%) 得た。

融点 161-163℃。

実施例120

(R) -4-(4-)リフルオロメチルベンジリデンアミノ)ピペラジン-1-カルボン酸2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b]

実施例103で製造した(R)-4-(4-トリフルオロメチルベンジリデン

20 オキサゾールー2ーイルメチルエステルの製造

アミノ) ピペラジン-1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル(4.03g、7.77ミリモル)のDMF(20ml)溶液に氷冷撹拌下、水素化ナトリウム(0.37g、9.32ミリモル)を加え、0℃で1時間撹拌した。反応液に氷水を加え、析出物を濾取し水で洗浄し、アセトニトリル及びイソプロパノールから再結晶し、白色固体の(R)-4-(4-トリフルオロメチルベンジリデンアミノ)ピペラジン-1-カルボン酸2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ「2,1-b]オキサゾール-2-イルメチルエステル(2.60g、

収率69%)を得た。

融点 176-178℃。

実施例121

(R) -4-(4-トリフルオロメチルフェニルアミノ) ピペリジン-1-カル 5 ボン酸2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダブ [2, 1-b] オキ サゾール-2-イルメチルエステルの製造

実施例105で製造した(R)-4-(4-)リフルオロメチルフェニルアミノ)ピペリジン-1-カルボン酸3-(2-)クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル(1.44g、2.

- 10 85ミリモル)のDMF(10ml)溶液に氷冷撹拌下、水素化ナトリウム(0. 14g、3.42ミリモル)を加え、更に0℃で1時間撹拌した。反応液に氷水 を加え、酢酸エチルで抽出し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃 縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル)により精製 し、アセトニトリルとイソプロパノールから再結晶し、白色固体の(R)-4-
- 15 (4ートリフルオロメチルフェニルアミノ)ピペリジン-1-カルボン酸2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2ーイルメチルエステル(0.42g、収率31%)を得た。

融点 137-140℃。

実施例122

20 (R) -4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジン-1-カルボン酸2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステルの製造

実施例104で製造した(R)-4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジン-1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-

25 イル) -2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル (0.18g、0.36 ミリモル) のDMF (2ml) 溶液に氷冷撹拌下、水素化ナトリウム (19mg、0.47ミリモル) を加え、更に0℃で1.5時間撹拌した。反応液に氷水を加え、酢酸エチルで抽出し、水で洗浄して硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=

9/1) により精製し、イソプロパノールから再結晶し、白色固体の(R) -4 - (4-トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジン-1-カルボン酸2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステル(0.08g、収率47%)を得た。

5 融点 165-166℃。

実施例123

- (R) 4 (4 h) フルオロメチルフェニル) 1, 2, 3, 6 F h ラヒドロピリジン- 1 D ルボン酸 2λ チル- 6 E h ロー2, $3 \mathcal{O}$ ヒドロイミダゾ [2, 1 b] オキサゾール $2 \mathcal{O}$ イルメチルエステルの製造
- 実施例106で製造した(R) -4-(4-トリフルオロメチルフェニル) -1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-カルボン酸3-(2-クロロー4-ニトロイミダゾールー1ーイル) -2-ヒドロキシー2ーメチルプロピルエステル(0.32g、0.65ミリモル)のDMF(3m1)溶液に氷冷撹拌下、水素化ナトリウム(31mg、0.78ミリモル)を加え、更に0℃で1.5時間撹拌した。反応液に氷水を加え、酢酸エチルで抽出し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=9/1)により精製し、イソプロパノールから再結晶し、白色固体の(R) -4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-カルボン酸2-メチル-6-ニトロ-2,
- 20 3ージヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチルエステルを (0.14g、収率49%) 得た。

光学純度 98.4%ee

 $[\alpha]_{D}^{26} = +2.50^{\circ} (c0.560, CHCl_{3})_{\circ}$

融点 169-171℃。

25 実施例124

(R) -5-クロロー 2, 3-ジヒドロインドールー 1-カルボン酸 2-メチル -6-ニトロー 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー 2-イルメチルエステルの製造

実施例113で製造した(R)-5-クロロー2,3-ジヒドロインドール-

1 ーカルボン酸 3 ー (2 ークロロー4 ーニトロイミダゾールー1 ーイル) ー 2 ー ヒドロキシー2 ーメチルプロピルエステル (0.60g、1.44ミリモル) の DMF (6 m 1) 溶液に氷冷撹拌下、水素化ナトリウム (7 0 m g、1.73ミリモル)を加え、更に0℃で1時間撹拌した。反応液に氷水を加え、析出物を濾取し、水で洗浄した。これをアセトニトリルとイソプロパノールから再結晶し、白色固体の (R) ー5 ークロロー2,3 ージヒドロインドールー1 ーカルボン酸2 ーメチルー6ーニトロー2,3 ージヒドロイミダゾ[2,1-b] オキサゾールー2ーイルメチルエステル (0.30g、収率55%)を得た。融点 189-191℃。

10 実施例125

(R) -5-クロロ-1, 3-ジヒドロイソインドール-2-カルボン酸2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステルの製造

実施例114で製造した(R) -5-クロロ-1, 3-ジヒドローイソインド

15 ールー2ーカルボン酸3ー(2ークロロー4ーニトロイミダゾールー1ーイル)
-2ーヒドロキシー2ーメチルプロピルエステル(0.13g、0.31ミリモル)のDMF(2m1)溶液に氷冷撹拌下、水素化ナトリウム(15mg、0.37ミリモル)を加え、更に0℃で1時間撹拌した。反応液に氷水を加え、酢酸エチルで抽出し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル)により精製し、微黄色固体の(R) -5-クロロ-1, 3-ジヒドロイソインドールー2ーカルボン酸2ーメチルー6ーニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾールー2ーイルメチルエステル(7mg、収率6%)を得た。融点 182℃(分解)。

25 実施例126

(R) -6-クロロ-3, 4-ジヒドロ-1 H-イソキノリン-2-カルボン酸 2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステルの製造

実施例115で製造した(R)-6-クロロ-3,4-ジヒドロ-1H-イソ

キノリン-2-カルボン酸3-(2-クロロー4-ニトロイミダゾール-1ーイル) -2-ヒドロキシー2ーメチルプロピルエステル (0.26g、0.61ミリモル) のDMF (2m1) 溶液に氷冷撹拌下、水素化ナトリウム (30mg、0.73ミリモル) を加え、更に0℃で1時間撹拌した。氷水を加え、酢酸エチルで抽出し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。イソプロパノールから再結晶し、微黄色固体の (R) -6-クロロー3, 4-ジヒドロー1H-イソキノリン-2-カルボン酸2-メチル-6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステル (0.12g、49%) を得た。

10 融点 180-182℃。

実施例127

- (R) -6-クロロー3, 4-ジヒドロー2H-キノリンー1-カルボン酸2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2-イルメチルエステルの製造
- 実施例116で製造した(R) -6-クロロー3, 4-ジヒドロー2H-キノリン-1-カルボン酸3-(2-クロロー4-ニトロイミダゾールー1ーイル)-2-ヒドロキシー2-メチルプロピルエステル(1.84g、4.29ミリモル)のDMF(10ml)溶液に氷冷撹拌下、水素化ナトリウム(0.21g、5.15ミリモル)を加え、更に0℃で1時間撹拌した。反応液に氷水を加え、
- 20 酢酸エチルで抽出し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。 残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=9/1)により精製し、アセトニトリルとイソプロパノールから再結晶し、白色固体の(R)-6-クロロー3,4-ジヒドロー2H-キノリン-1-カルボン酸2-メチル-6-ニトロ-2、3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール
- 25 2-イルメチルエステル (0.68g、収率40%) を得た。

融点 172-174℃。

実施例128

2-メチルー6-ニトロー2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシメチル) -2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾールの製造 4ートリフルオロメトキシフェノール(198mg、1.11ミリモル)をDMF(5ml)に溶解した。この溶液に、室温下水素化ナトリウム(48mg、1.21ミリモル)を加え、80℃に昇温しつつ20分加熱撹拌した。これを氷冷し、実施例6で製造した2ークロロー1ー(2ーメチルオキシラニルメチル)5 ー4ーニトロイミダゾール(220mg、1.01ミリモル)を加え、80℃に昇温しつつ更に15分加熱撹拌した。反応液を氷水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。これを飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=10/1)で分離精製し、更に塩化メチレンージイソプロピルエーテルよる結晶化を行い、濾取後減圧乾燥することにより白色粉末の2ーメチルー6ーニトロー2ー(4ートリフルオロメトキシフェノキシメチル)ー2、3ージヒドロイミダゾ [2、1ーb]オキサゾール(170mg、収率47%)を得た。

融点 126.8-127.9℃

15 MS 358 (M-1) +

実施例129

2-メチルー6ーニトロー2- $\{4-$ [4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジンー1-イル] フェノキシメチル $\}$ -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造

4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)ピペリジン]-1-イルフェノール(244mg、0.69ミリモル)をDMF(10m1)に溶解した。この溶液に、室温下水素化ナトリウム(33mg、0.83ミリモル)を加え、80℃に昇温しつつ20分加熱撹拌した。これを氷冷し、実施例6で製造した2ークロロー1-(2-メチルー2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール(150mg、0.69ミリモル)を加え、80℃に昇温しつつ更に20分加熱撹拌した。反応液に氷水を加え、激しく撹拌し、析出物を濾取し、水洗した。これを塩化メチレンに溶解し、飽和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=10/1)で分離精製し、更に塩化

メチレン/酢酸エチルよる結晶化により白色粉末の2-メチルー6-ニトロー2-4ー [4ー (4ートリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジンー1-イル] フェノキシメチル} ー 2, 3ージヒドロイミダゾ [2, 1ーb] オキサゾール (103 mg、収率 28%) を得た。

5 融点 165.4-166.3℃。

実施例130

2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-$ [4- (4-トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル $\}$ -2 , 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造

- 10 4-[4-(4-)リフルオロメチルフェニル)ピペラジン-1-イル]フェノール(296mg、0.92ミリモル)をDMF(10m1)に溶解した。この溶液に室温下水素化ナトリウム(44mg、1.1ミリモル)を加え、 80° に昇温しつつ20分加熱撹拌した。これを氷冷し、実施例6で製造した2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール
- 15 (200mg、0.92ミリモル)を加え、80℃に昇温しつつ更に20分加熱 撹拌した。反応液に氷水を加え、激しく撹拌し、析出物を濾取し、水洗した。こ れを塩化メチレンに溶解し、飽和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾 過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマト グラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=10/1)で分離精製し、更に塩化メ
- 20 チレン/酢酸エチルよる結晶化により白色粉末の2-メチルー6-ニトロー2-{4-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジンー1-イル]フェノキシメチル}-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール(178 mg、収率38%)を得た。

融点 230.7-233.1℃。

25 実施例131

4-[4-(2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメトキシ)フェニル] ピペラジンー<math>1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

4- (4-ヒドロキシフェニル) ピペラジン-1-カルボン酸 tertーブチ

ルエステル(2.01g、7.23ミリモル)をDMF(20m1)に溶解した。この溶液に室温下水素化ナトリウム(320mg、8ミリモル)を加え、70 $^{\circ}$ に昇温しつつ20分加熱撹拌した。これを氷冷し、実施例6で製造した2 $^{\circ}$ -クロロー1 $^{\circ}$ -(2 $^{\circ}$ -メチル $^{\circ}$ -2 $^{\circ}$ -オキシラニルメチル) $^{\circ}$ -4 $^{\circ}$ -ニトロイミダゾール

- 5 (1.5g、7.23ミリモル)を加え、80℃に昇温しつつ更に20分加熱撹拌した。反応液に氷水を加え、激しく撹拌し、析出物を濾取し、水洗した。これを塩化メチレンに溶解し、飽和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=20/1)で分離精製し、更に塩化メチ
- 10 レンー酢酸エチルによる結晶化を行い、濾取後減圧乾燥することにより白色粉末 の4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメトキシ)フェニル] ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル(1.5g、収率45%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

- 15 1. 48 (9H, s), 1. 77 (3H, s), 2. 99-3. 03 (4H, m), 3. 55-3. 59 (4H, m), 4. 02 (1H, d, J=10. 2 Hz), 4. 04 (1H, d, J=10. 1Hz), 4. 18 (1H, d, J=10. 1Hz), 4. 49 (1H, d, J=10. 2Hz), 6. 76-6. 8 1 (2H, m), 6. 84-6. 89 (2H, m), 7. 55 (1H, s)
- 20 融点 212.0-214.5℃

 $MS 459 (M^{+})$.

実施例132

25

4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメトキシ)フェニル] ピペリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステルの製造

4-(4-ビドロキシフェニル)ピペリジン-1-カルボン酸 t e r t - ブチルエステル(364 m g、1.31 = リモル)をDMF(10 m = 1)に溶解した。この溶液に室温下水素化ナトリウム(58 m = = 1.44 = リモル)を加え、= = 0 = = 100 = 20 = 分加熱撹拌した。これを氷冷し、実施例 = 6 で製造した = 2 = = 2 = 2 = 2 = 3 = 4 = 3 = 4 = 9 = 2 = 4 = 9 = 2 = 2 = 3 = 4 = 9 = 2 = 3 = 4 = 9 = 2 = 3 = 4 = 9 = 2 = 3 = 4 = 9 = 2 = 3 = 4 = 9 = 9 = 2 = 2 = 3 = 4 = 9 = 9 = 2 = 3 = 9 = 9 = 9 = 2 = 9 =

クロロー1ー(2ーメチルー2ーオキシラニルメチル)ー4ーニトロイミダゾール(300mg、1.38ミリモル)を加え、80℃に昇温しつつ更に20分加熱撹拌した。反応液に氷水を加え、激しく撹拌し、析出物を濾取し、水洗した。これを塩化メチレンに溶解し、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、5 濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=200/1)で分離精製し、更に塩化メチレン/ジイソプロピルエーテルよる結晶化により、白色粉末の4ー[4ー(2ーメチルー6ーニトロー2,3ージヒドロイミダゾ[2,1ーb]オキサゾールー2ーイルメトキシ)フェニル]ピペリジンー1ーカルボン酸tertーブ10 チルエステル(248mg、収率41%)を得た。

融点 207.8-209.1℃。

実施例133

15

4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメトキシ)フェニル] ピペラジン-1-カルボン酸 3, 4-ジクロロベンジルエステルの製造

実施例131で製造した4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒ ドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメトキシ) フェニル] ピペ ラジンー1ーカルボン酸tert-ブチルエステル(118mg、0.26ミリ モル)を塩化メチレン5m1に溶解し、トリフルオロ酢酸(5m1)を加え3時 間室温で撹拌した。反応液を減圧下濃縮し、塩化メチレン及びトリエチルアミン 20 を2mlずつ加えた。反応液を室温で5分撹拌した後、減圧下濃縮し、残渣をD MF (15ml) に溶解した。そこへ3, 4-ジクロロベンジルアルコール (<math>136 mg、0.77 S リモル)及び1,1' ーカルボニルジイミダゾール(125 mg、 0. 77ミリモル)をDMF (5 ml) に溶解し3時間室温で撹拌して 調製した溶液を加え、室温で終夜撹拌した。反応液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽 25 出後、有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得 られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=200/1)により分離精製した。塩化メチレン ーイソプロピルエーテルより結晶化を行い、濾取後減圧乾燥することにより、微

黄色粉末の4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメトキシ)フェニル] ピペラジンー<math>1-カルボン酸3, 4-ジクロロベンジルエステル(<math>101mg、収率70%)を得た。

- 5 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:
 - 1. 77 (3H, s), 3. 01-3. 06 (4H, m), 3. 62-3. 67 (4H, m), 4. 02 (1H, d, J=10. 2Hz), 4. 04 (1H, d, J=10. 2Hz), 4. 18 (1H, d, J=10. 2Hz), 4. 49 (1H, d, J=10. 2Hz), 5. 09 (2H, s), 6. 76-6. 81 (2
- 10 H, m), 6.84-6.89 (2H, m), 7.18-7.22 (1H, m), 7.41-7.47 (2H, m), 7.55 (1H, s).

実施例134

2-メチルー6-ニトロー2- $\{4-$ [4-(4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジンー1-イル] フェノキシメチル $\}$ -2, 3-ジヒドロイミダゾ

15 [2, 1-b] オキサゾールの製造

実施例131で製造した4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒ ドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメトキシ) フェニル] ピペ ラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(88mg、0.19ミリモ ル)をトリフルオロ酢酸(5m1)に溶解し、5時間室温で撹拌した。反応液を 減圧下濃縮し、塩化メチレン及びトリエチルアミンを2mlずつ加えた。室温5 20 分撹拌した後、減圧下濃縮した。残渣をジクロロエタンに溶解し、氷冷下4-ト リフルオロメチルベンズアルデヒド (40μ1、0.29ミリモル) 及びトリア セトキシ水素化ホウ素ナトリウム(82mg、0.38ミリモル)を加え、室温 まで昇温した後、終夜撹拌した。これに飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び塩化 メチレンを加えて撹拌し、塩化メチレンで抽出した。有機相を硫酸マグネシウム 25 で乾燥後、減圧濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲ ルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=200/1)により 分離精製した。塩化メチレン一酢酸エチルより結晶化を行い、濾取後減圧乾燥す ることにより、白色粉末の2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-ト

リフルオロメチルベンジル)ピペラジン-1-イル]フェノキシメチル}-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (53mg、収率53%)を 得た。

融点 171.8-173.1℃。

実施例132で製造した4-[4-(2-メチル-6-ニトロー2,3-ジヒ 5 ドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメトキシ)フェニル] ピペ リジン-1-カルボン酸 tertーブチルエステルを用い、実施例134と同様 にして、実施例135の化合物を製造した。

実施例135

2-メチルー6-ニトロー2ー {4-[1-(4-トリフルオロメトキシベンジ 10 ル) ピペリジンー4ーイル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

収率45%、融点 160.6-161.1℃。

実施例136

- (R) -2-メチル-6-ニトロ-2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ 15 メチル)-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾールの製造 4-トリフルオロメトキシフェノール (1.1g、6.17ミリモル) をDM F(20m1)に溶解した。この溶液に室温下水素化ナトリウム(260mg、 6. 45ミリモル)を加え、80℃に昇温しつつ15分加熱撹拌した。これを氷 冷し、実施例12で製造した(R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキ 20 シラニルメチル) -4-ニトロイミダゾール (1.22g、5.61ミリモル) を加え、80℃に昇温しつつ更に2時間加熱撹拌した。反応液を氷水に注ぎ、激 しく撹拌した後、析出物を濾取し、水洗した。これを塩化メチレンに溶解し、飽 和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濾過した。得られた濾液を減 圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン 25 /酢酸エチル=10/1)で分離精製し、更に塩化メチレンージイソプロピルエ
 - ーテルよる結晶化を行い、濾取後減圧乾燥することにより白色粉末の(R)-2 ーメチルー6-ニトロー2ー(4-トリフルオロメトキシフェノキシメチル)ー 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (1.03g、収率51

672

%)を得た。

光学純度 >99%ee

 $[\alpha]_D^{28} = 7.67^{\circ}$ (濃度: 1.030, CHCl₃)

 $MS 359 (M^{+})$

5 融点 176.5-178.0℃。

対応する出発原料を用い、実施例136と同様にして、実施例137〜実施例139の化合物を製造した。

実施例137

- (R) -2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(チオモルホリン-4-イル)フ
- 10 エノキシメチル] -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール 収率38%、融点 227.5-229.0℃、MS 376 (M⁺)。 実施例138
- 15 収率44%、融点 172-175℃。

実施例139

- (R) -2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(1, 2, 4-トリアゾール-1-イル) フェノキシメチル] -2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b] オキサゾール
- 20 収率53%、融点 236.0-238.7℃。

1-(4-ヒドロキシフェニル)ピペリジン-4-カルボン酸エチルエステルを用い、実施例136と同様にして、実施例140の化合物を製造した。

実施例140

- (R) -1-[4-(2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2,
- 25 1-b] オキサゾールー2-イルメトキシ) フェニル] ピペリジンー4-カルボン酸エチルエステル

収率30%、融点 208.2-211.5℃。

実施例141

(R) -2-メチル-6-ニトロ-2- {4-[4-(4-トリフルオロメトキ

シフェノキシ)ピペリジン-1-イル]フェノキシメチル $\}$ -2,3-ジヒドロイミダブ [2,1-b]オキサゾールの製造

4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)ピペリジン-1-イル]フェノール(17.4g、49.0ミリモル)をDMF(150m1)に溶解した。この反応液に室温下水素化ナトリウム(2.15g、53.8ミリモル)を加え、80℃に昇温しつつ20分加熱撹拌した。これを氷冷し、実施例12で製造した(R)-2-クロロ-1-(2-メチルオキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール(14.9g、68.6ミリモル)を加え、80℃に昇温しつつ更に20分加熱撹拌した。反応液に氷水を加え、激しく撹拌し、析出物を濾取し、

- 10 水洗した。これを塩化メチレンに溶解し、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=10/1)で分離精製し、更に塩化メチレン/酢酸エチルよる結晶化により淡黄色粉末の(R)-2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキ
- 15 シ)ピペリジン-1-イル]フェノキシメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(14.3g、収率55%)を得た。

 $MS 535 (M+1)^{+}$

光学純度 99.9%ee

 $[\alpha]_{D}^{28} = -9.94^{\circ}$ (濃度: 1.006, CHCl₃)

20 融点 194.5-196℃

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 77 (3H, s), 1. 87-2. 00 (2H, m), 2. 05-2. 16 (2H, m), 2. 95-3. 05 (2H, m), 3. 32-3. 41 (2H, m), 4. 02 (1H, d, J=10. 2Hz), 4. 04 (1H, d, J=10. 2Hz), 4. 18 (1H, d, J=10. 2Hz), 4. 36-4. 45

25 0. 2Hz), 4. 18 (1H, d, J=10. 2Hz), 4. 36-4. 45 (1H, m), 4. 49 (1H, d, J=10. 2Hz), 6. 74-6. 81 (2H, m), 6. 87-6. 94 (4H, m), 7. 11-7. 16 (2H, m), 7. 55 (1H, s).

実施例142

(R) -2-メチル-6 -ニトロ-2 $- \{4-[4-(4-$ トリフルオロメトキシフェニル)ピペラジン-1 -イル]フェノキシメチル $\}$ -2, 3 -ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールの製造

4- [4-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン-1-イル] フ 5 ェノール (1.7g、5.02ミリモル) をDMF (20m1) に溶解した。こ の溶液に室温下水素化ナトリウム (221m、5.53ミリモル) を加え、80 ℃に昇温しつつ20分加熱撹拌した。これを氷冷し、実施例12で製造した

(R)-2-クロロ-1-(2-メチルオキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール(1.2g、5.53ミリモル)を加え、80 \mathbb{C} に昇温しつつ更に20

10 分加熱撹拌した。反応液に氷水を加え、激しく撹拌し、析出物を濾取し、水洗した。これを塩化メチレンに溶解し、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=10/1)で分離精製し、更に酢酸エチルから再結晶を行い、淡黄色粉末の(R)-2-メチルー6-ニト

15 $p-2-\{4-[4-(4-h)]$ アルオロメトキシフェニル) ピペラジン-1-4 イル] フェノキシメチル $\}-2$, 3-ジヒドロイミダゾ <math>[2, 1-b] オキサゾール (1.02g、収率39%) を得た

 $MS 519 (M^{+})$

光学純度 >99 %ee

20 [α]_D²⁸=-18.02° (濃度:1.160, CHCl₃) 融点 262.5-265℃。

実施例143

(R) -4-[4-(2-メチル-6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメトキシ) フェニル] ピペリジンー1ーカルボ
 25 ン酸tertーブチルエステルの製造

4-(4-ビドロキシフェニル)ピペリジン-1-カルボン酸 t e r t - ブチルエステル(1.07g、3.86ミリモル)をDMF10mlに溶解した。この溶液に室温下水素化ナトリウム(185 mg、4.63ミリモル)を加え、80℃に昇温しつつ20分加熱撹拌した。これを氷冷し、実施例12で製造した

(R) -2-クロロ-1-(2-メチルオキシラニルメチル) -4-ニトロイミダゾール923mg(4.24ミリモル)を加え、80℃に昇温しつつ更に20分加熱撹拌した。反応液に氷水を加え、激しく撹拌し、析出物を濾取し、水洗した。これを塩化メチレンに溶解し、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾5燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=200/1)で分離精製し、更に酢酸エチル/ジイソプロピルエーテルよる結晶化により白色粉末の(R) -4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメトキシ)フェニル]ピペリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(857mg、収率48%)を得た。

 $MS 458 (M^{+})$

光学純度 >99 %ee

[α]_D²⁸=-1.07° (濃度:1.028, CHCl₃) 融点 227.5-228.3℃ (分解)。

15 対応する出発原料を用い、実施例143と同様にして、実施例144の化合物 を製造した。

実施例144

(R) -4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメトキシ) フェニル] <math>-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-カルボン酸 t e r t -ブチルエステル

 $MS 438 (M-18)^{+}$

融点 183.0-189.0℃(分解)。

実施例145

20

- (R) -4- [4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2,
- 25 1-b] オキサゾールー 2-イルメトキシ)ベンゾイル] ピペラジンー1-カル ボン酸 t e r t ブチルエステルの製造
 - 4-(4-ビドロキシベンゾイル)ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (6.6g, 21.5ミリモル)をDMF 50m に溶解した。この溶液に室温下水素化ナトリウム (991mg, 24.8ミリモル)を加え、8

0℃に昇温しつつ20分加熱撹拌した。これを氷冷し、実施例12で製造した (R) -2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル) -4-ニトロイミダゾール5.16(23.7ミリモル)を加え、80℃に昇温しつつ更に20分加熱撹拌した。反応液に氷水を加え、激しく撹拌し、析出物を濾取し、水5 洗した。これを塩化メチレンに溶解し、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=100/1)で分離精製し、更に塩化メチレン/ジイソプロピルエーテルよる結晶化により白色粉末の(R) -4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ「2.

10 1-b] オキサゾール-2-イルメトキシ) ベンゾイル] ピペラジン-1-カルボン酸 t e r t - ブチルエステル(7.35<math>g、収率70%)を得た。

 $MS 488 (M+1)^{+}$

融点 222.5-224.0℃。

実施例146

15 (R) -4-[2-0ロロー4-(2-3) (R) -4-[2-0] (R) -4-[2-0] (2-3) -4-[2-0] (2-4) -4-[2-0] (2-3) -4-[2-0] (2-4) -4-[2

 $4-(2-\rho - 4-\nu + \nu - 4-\nu$

- 20 溶解した。この溶液に室温下水素化ナトリウム(397mg、9.92ミリモル)を加え、80℃に昇温しつつ20分加熱撹拌した。これを氷冷し、実施例12で製造した(R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール(2.1g、9.50ミリモル)を加え、80℃に昇温しつつ更に20分加熱撹拌した。反応液に氷水を加え、激しく撹拌し、析25 出物を濾取し、水洗した。これを塩化メチレンに溶解し、飽和食塩水で洗浄し、

ロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー 2 ーイルメトキシ)フェニル] ピペラジンー 1 ーカルボン酸 t e r t ーブチルエステル(2 . 3 4 g 、収率 5 5 %)を得た。

 $MS 493 (M^{+})$

5 融点 207.0-209.5℃。

実施例147

- (R) -4-[3-(2-メチル-6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメトキシ) フェニル] ピペラジンー<math>1-カルボン酸 tert tert
- 4-(3-ヒドロキシフェニル)ピペラジン-1-カルボン酸tertーブチルエステル(3.23g、11.6ミリモル)をDMF40mlに溶解した。この溶液に室温下水素化ナトリウム557mg(13.9ミリモル)を加え、70℃に昇温しつつ20分加熱撹拌した。これを氷冷し、実施例12で製造した
- (R) -2-クロロー1-(2-メチルー2-オキシラニルメチル) -4-ニト 15 ロイミダゾール2.78g(12.8ミリモル)を加え、80℃に昇温しつつ更 に20分加熱撹拌した。反応液に氷水を加え、激しく撹拌し、析出物を濾取し、 水洗した。これを塩化メチレンに溶解し、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウ ムで乾燥後、減圧濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカ ゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=100/1)で分
- 20 離精製し、更に塩化メチレン-酢酸エチルよる結晶化を行い、濾取後、減圧乾燥することにより白色粉末の(R)-4-[3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメトキシ)フェニル]ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(1.4g、収率26%)を得た。
- 25 MS 459 (M⁺) 融点 179.5-182.0℃。

実施例148

(R) -4-[4-(2-メチル-6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメトキシ) フェニル] ピペラジンー<math>1-カルボ

ン酸tertーブチルエステルの製造

4- (4-ヒドロキシフェニル) ピペラジン-1-カルボン酸 tertーブチ ルエステル(13.5g、48.8ミリモル)をDMF100mlに溶解した。 この溶液に室温下水素化ナトリウム (2.15g、53.7ミリモル)を加え、 70℃に昇温しつつ20分加熱撹拌した。これを氷冷し、実施例12で製造した 5 (R) -2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル) -4-ニト ロイミダゾール (10.6g、48.8ミリモル) を加え、80℃に昇温しつつ 更に20分加熱撹拌した。反応液に氷水を加え、激しく撹拌し、析出物を濾取し、 水洗した。これを塩化メチレンに溶解し、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウ ムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲル 10 カラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=100/1)で分離精 製し、更に塩化メチレン-酢酸エチルよる結晶化を行い、濾取後、減圧乾燥する ことにより白色粉末の(R)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメトキシ) フェニル] ピペラジン-1-カルボン酸 t e r t - ブチルエステル (9.9 g、収率44

光学純度 > 99.5% e e

[α]_D²⁸=-10.85° (濃度:1.014, CHCl₃) MS 459 (M⁺)

20 融点 230-232℃

%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 48 (9H, s), 1. 76 (3H, s), 2. 99-3. 03 (4H, s)

m), 3. 54-3. 59(4H, m), 4. 02(1H, d, J=10.2

Hz), 4. 04 (1H, d, J=10.1Hz), 4. 18 (1H, d, J=10.1Hz)

25 10. 1Hz), 4. 49 (1H, d, J=10.2Hz), 6. 76-6. 8

1 (2H, m), 6. 85-6. 89 (2H, m), 7. 58 (1H, s).

実施例149

(R) - [4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1]

-b] オキサゾール-2-イルメトキシ) フェニル] ピペラジン二塩酸塩の製造

実施例148で製造した(R)-4-[4-(2-メチルー6-ニトロー2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールー2ーイルメトキシ)フェニル]ピペラジン-1ーカルボン酸tertーブチルエステル(300mg、0.65ミリモル)をトリフルオロ酢酸5mlに溶解し、3時間室温で撹拌した。反応液を減圧下濃縮し、残渣をメタノールに溶解した。これに飽和塩化水素酢酸エチル溶液を5ml加え、析出物を濾取後、減圧乾燥することにより、淡黄色粉末の(R)-[4-(2-メチルー6-ニトロー2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールー2ーイルメトキシ)フェニル]ピペラジン二塩酸塩(279mg、収率99%)を得た。

10 MS $359 (M^+)$

融点 212-220℃ (分解)

 1 H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

1. 67 (3H, s), 3. 22-3. 31 (8H, m), 4. 18 (1H, d, J=10. 9Hz), 4. 23 (2H, s), 4. 37 (1H, d, J=10.

15 9Hz), 6. 85 (2H, d, J=9. 1Hz), 7. 00 (2H, d, J=9. 1Hz), 8. 16 (1H, s), 9. 37 (3H, br).

実施例150

(R) -2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-$ [4-(4-トリフルオロメチル ベンジル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル $\}$ -2, 3-ジヒドロイミ

20 ダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造

実施例148で製造した(R)-4-[4-(2-メチルー6-ニトロー2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールー2ーイルメトキシ)フェニル]ピペラジンー1ーカルボン酸tertーブチルエステル(800mg、1.74ミリモル)及びトリフルオロ酢酸(3m1)の混合物を7時間室温で撹拌した。反応液を減圧下濃縮し、残渣を塩化メチレン10m1に溶解し、トリエチルアミン3m1(21.52ミリモル)を加え、室温下にて5分撹拌した後、減圧下にて濃縮した。残渣をメタノール10m1に溶解し、氷冷下4ートリフルオロメチルベンズアルデヒド(910mg、5.23ミリモル)、シアノトリヒドロ

ホウ酸ナトリウム(328mg、5.23ミリモル)及び酢酸 0.33ml(5.

23ミリモル)を加え、室温まで昇温させ終夜撹拌した。飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、塩化メチレンを加え撹拌して塩化メチレンで抽出した。有機相を硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=200/

1)により分離精製することにより、微黄色粉末の(R)-2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-$ [4- (4-トリフルオロメチルベンジル)ピペラジン-1-イル]フェノキシメチル $\}$ -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール(6 6 7 m g、 $\sqrt{2}$ \sqrt

融点 205.5-207℃。

10 実施例151

(R) -4-[4-(2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメトキシ) フェニル] ピペラジンー<math>1-カルボン酸エチルエステルの製造

実施例148で製造した(R)-4-「4-(2-メチルー6-ニトロー2. 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2-イルメトキシ)フェニ・ 15 ル] ピペラジン-1-カルボン酸 t e r t -ブチルエステル (300 m g , 0.65ミリモル)を塩化メチレン5m1に溶解し、トリフルオロ酢酸5m1を加え、 3時間室温で撹拌した。反応液を減圧下濃縮し、塩化メチレン5m1及びトリエ チルアミン2mlを加え、続いてクロロギ酸エチル(0.11ml、1.31ミ リモル)を加え室温で1時間撹拌した。反応液を水に注ぎ、塩化メチレンで抽出 20 後、有機相を飽和食塩水で洗浄した。硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得 られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=200/1)により分離精製し、塩化メチレン-イソプロピルエーテルより結晶化を行い、濾取後、減圧乾燥することにより、白 25 色粉末の(R)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミ ダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2-イルメトキシ) フェニル] ピペラジン-

[α] $_{D}^{28}$ =-9.86° (濃度:1.014, CHCl $_{3}$)。 MS 431 (M^{+})

1-カルボン酸エチルエステル (182mg、収率65%) を得た。

融点 210.5-212.0℃。

実施例152

(R) -4-[4-(2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメトキシ) フェニル] ピペラジンー<math>1-カルボン酸4-クロロベンジルエステルの製造

実施例148で製造した $(R) - 4 - [4 - (2 - \chi f) - 6 - h - 2, 3 - \psi + \psi + 2 - \chi f$ [2, 1 - b] オキサゾール $-2 - \chi f$ [2, 1 - b] オキカゾール $-2 - \chi f$ [2, 1 - b] オキカゾール $-2 - \chi f$ [2, 1 - b] オキカゾール $-2 - \chi f$ [2, 1 - b] オキカゾール

- 10 3時間室温で撹拌した。反応液を減圧下濃縮し、塩化メチレン及びトリエチルアミンを2mlずつ加えた。室温5分撹拌した後、減圧下濃縮し、残渣をDMF15mlに溶解した。そこへ4ークロロベンジルアルコール(186mg、1.31ミリモル)、1,1'ーカルボニルジイミダゾール(212mg、1.31ミリモル)をDMF5mlに溶解し3時間室温で撹拌した混合物を加え、室温で終
- 15 夜撹拌した。反応液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出後、有機相を飽和食塩水で洗浄した。硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=200/1)により分離精製した。塩化メチレンーイソプロピルエーテルより結晶化を行い、濾取後減圧乾燥することにより、微黄色粉末の(R)-4-[4
- 20 (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサ ゾール-2-イルメトキシ)フェニル]ピペラジン-1-カルボン酸4-クロロ ベンジルエステル(313mg、収率91%)を得た。

 $[\alpha]_D^{28} = -10.84^{\circ}$ (濃度: 1.006, CHCl₃) MS 527 (M⁺)

25 融点 184.5-187.5℃。

対応する出発原料を用い、実施例152と同様にして、実施例153の化合物を製造した。

実施例153

(R) -4-[4-(2-メチルー6ーニトロー2, 3ージヒドロイミダゾ [2,

1-b] オキサゾールー2ーイルメトキシ) フェニル] ピペラジンー1ーカルボン酸5-クロロベンゾフランー2-イルメチルエステル

収率79%、融点 195-197℃。

実施例143で製造した(R)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,

- 5 3ージヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメトキシ)フェニル]ピペリジンー1ーカルボン酸tertーブチルエステル、実施例144で製造した(R)ー4ー[4ー(2ーメチルー6ーニトロー2, 3ージヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメトキシ)フェニル]ー1, 2, 3,6ーテトラヒドロピリジンー1ーカルボン酸tertーブチルエステル、実施例
- 10 145で製造した (R) -4-[4-(2-メチル-6-ニトロー2, 3-ジヒトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメトキシ)ベンゾイル] ピペラジンー1ーカルボン酸 <math>tertorall tertorall tert
- 15 カルボン酸 t e r t ーブチルエステルを用い、実施例 1 5 2 と同様にして、実施 例 1 5 4 ~ 実施例 1 5 8 の化合物を製造した。

実施例154

- $(R) 4 [4 (2 \cancel{y} + \cancel{v} 6 - 1 2, 3 \cancel{y} + \cancel{v} + 2 4 2, 3 \cancel{y} + 2 4 2, 3 2 4 2, 3 2, 3 2$
- 20 ン酸4-トリフルオロメトキシベンジルエステル

収率54%、融点 202.5-204℃。

実施例155

- (R) -4-[4-(2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメトキシ) フェニル] <math>-1, 2, 3, 6-テト
- 25 ラヒドロピリジン-1-カルボン酸4-トリフルオロメトキシベンジルエステル 収率67%、融点 174.3-174.8℃。

実施例156

ボン酸 4-トリフルオロメトキシベンジルエステル 収率 8.6%、融点 1.68.5-1.72%。

実施例157

(R) - 4 - [4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 4])

5 1-b]オキサゾール-2-イルメトキシ)ベンゾイル]ピペラジン-1-カルボン酸エチルエステル

収率85%、融点 132-135℃。

実施例158

(R) -4-[3-(2-メチルー6ーニトロー2, 3ージヒドロイミダゾ [2, ...]

10 1-b]オキサゾールー2ーイルメトキシ)フェニル]ピペラジンー1ーカルボン酸4ートリフルオロメトキシベンジルエステル

収率50%、融点 136.5-138℃。

実施例159

(R) -2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (4-トリフルオロメトキ 15 シベンジル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイ ミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造

実施例148で製造した(R)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イルメトキシ)フェニル] ピペラジン-<math>1-カルボン酸 tert-ブチルエステル(4.22g、9.

- 20 60ミリモル)を塩化メチレン10mlに溶解し、トリフルオロ酢酸30mlを加え5時間室温で撹拌した。反応液を減圧下濃縮し、塩化メチレン及びトリエチルアミンを10mlずつ加えた。これを室温で5分撹拌した後、減圧下濃縮した。残渣をジクロロエタンに溶解し、氷冷下に4ートリフルオロメトキシベンズアルデヒド(1.64ml、11.5ミリモル)及びトリアセトキシ水素化ホウ素ナ
- 25 トリウム (3.05g、14.4ミリモル) を加え、室温まで昇温した後、終夜 撹拌した。これに飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び塩化メチレンを加えて撹拌 し、塩化メチレンで抽出した。有機相を硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。 得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ ー(塩化メチレン/メタノール=200/1)により分離精製した。塩化メチレ

ン一酢酸エチルより結晶化を行い、濾取後減圧乾燥することにより、微黄色粉末の (R) -2 - λ + λ +

5 光学純度 > 99.5% e e

 $[\alpha]_D^{28} = -8.25^{\circ}$ (濃度: 1.018, CHC1₃)

 $MS = 533 (M^{+})$

融点 213.5-217℃。

実施例159の化合物は、下記実施例160でも製造した。

10 実施例 1 6 0

(R) -2-メチル-6 -ニトロ-2 $- \{4-[4-(4-$ トリフルオロメトキシベンジル)ピペラジン-1 -イル]フェノキシメチル $\}$ -2, 3 -ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾールの製造

4- [4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)ピペラジン-1-イル]フェノール3.36g(9.54ミリモル)をDMF20m1に溶解した。この溶液に、室温下水素化ナトリウム420mg(10.5ミリモル)を加え、80℃に昇温しつつ15分加熱撹拌した。これを氷冷し、実施例12で製造した(R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール2.18g(10.0ミリモル)を加え、80℃に昇温しつつ更に15分加熱撹拌した。反応液に氷水を加え、激しく撹拌した後、析出物を濾取し、水洗した。これを塩化メチレンに溶解し、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=100/1)で分離

25 により淡黄色粉末の(R) -2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (4- トリフルオロメトキシベンジル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル} -2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール(2.0g、収率40%)を得た。

実施例143で製造した(R)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,

精製し、更に塩化メチレンー酢酸エチルよる結晶化を行い、濾取後乾燥すること

10 実施例 1 6 1

収率45%、融点 186-188℃。

15 実施例162

(R) -2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-$ [1- (4-トリフルオロメトキシベンジル) -1, 2, 3, 6-テトラヒドロ-2 H-ピリジン-4-イル] フェノキシメチル $\}$ -2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b] オキサゾール収率61%、融点 168-174%。

20 実施例163

 $(R) - 4 - [4 - (2 - \cancel{y} + \cancel{v} - 6 - \cancel{z} - 1 - 1 - 2, 3 - \cancel{v} + \cancel{v} + \cancel{v} - \cancel{v} - 2 - 4 \cancel{v} + \cancel{v} + \cancel{v} + \cancel{v} + \cancel{v} - \cancel{v} - 2 - 4 \cancel{v} + \cancel{v}$

収率83%、融点 155-156℃。

25 実施例 1 6 4

(R) -4-[4-(2-メチル-6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメトキシ) フェニル] ピペラジンー<math>1-カルボン酸4-トリフルオロメトキシベンジルアミドの製造

実施例148で製造した(R)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,

3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2-イルメトキシ) フェニ ル] ピペラジン-1-カルボン酸 t e r t - ブチルエステル (120 m g 、0. 26ミリモル)を塩化メチレン5m1に溶解し、トリフルオロ酢酸5m1を加え 3時間室温で撹拌した。反応液を減圧下濃縮し、塩化メチレン及びトリエチルア ミン2mlずつを加えた。これを室温5分撹拌した後、減圧下濃縮し、残渣をD 5 MF10m1に溶解した。そこへ4-トリフルオロメトキシベンジルアミン (1 $25\,\mathrm{mg}$ 、 $0.65\,\mathrm{S\,J}$ モル)、1,1'-カルボニルジイミダゾール(110mg, 0.68ミリモル)をDMF5mlに溶解し、3時間室温で撹拌した混合 物を加え、室温で終夜撹拌した。反応液を水にあけ、酢酸エチルで抽出後、有機 相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液 10 を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチ レン/メタノール=200/1)により分離精製した。塩化メチレンーイソプロ ピルエーテルより結晶化を行い、濾取後減圧乾燥することにより、白色粉末の (R) -4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2]]15 1-b] オキサゾール−2-イルメトキシ) フェニル) ピペラジンー1-カルボ ン酸4ートリフルオロメトキシベンジルアミド(48mg、収率32%)を得た。

MS 558 (M-18) ⁺ 融点 166.5-168.5℃。

実施例165

20 (R) -2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメトキシベンゾイル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造

実施例148で製造した(R)-4-[4-(2-メチルー6-ニトロー2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールー2ーイルメトキシ)フェニ25 ル]ピペラジンー1ーカルボン酸tertーブチルエステル(300mg、0.65ミリモル)を塩化メチレン5mlに溶解し、これにトリフルオロ酢酸5mlを加え、5時間室温で撹拌した。反応液を減圧下濃縮し、塩化メチレン10ml及びトリエチルアミン2mlを加え、続いて4ートリフルオロメトキシベンゾイルクロリド(0.15ml、0.98ミリモル)加え、室温で1時間撹拌した。

反応液を水にあけ、塩化メチレンで抽出後、有機相を飽和食塩水で洗浄した。これを硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過し、得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=10/1)により分離精製した。塩化メチレンージイソプロピルエーテルより結晶化を行い、濾取後減圧乾燥することにより、白色粉末の(R)-2-メチルー6-ニトロー2-{4-[4-(4-トリフルオロメトキシベンゾイル)ピペラジンー1-イル]フェノキシメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(263mg、収率74%)を得た。

 $MS 547 (M^{+})$

10 融点 201.5-203.2℃。

実施例166

- (R) -2 λ + λ
- 実施例137で製造した(R) -2-メチルー6-ニトロー2ー[4-(チオモルホリンー4ーイル)フェノキシメチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(85mg、0.23ミリモル)を塩化メチレン5m1に溶解した。これにm-クロロ過安息香酸(59mg、0.24ミリモル)を加え、室温で20分撹拌した。反応液を塩化メチレンで希釈し、チオ硫酸ナトリウム水溶液、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣に塩化メチレンーイソプロピルエーテルによる結晶化を行い、濾取後乾燥することにより、白色粉末の(R)-2-メチルー6-ニトロ-2-[4-(1-オキソチオモルホリン-4-イル)フェノキシメチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]

 $MS 392 (M^{+})$

25

融点 198-200℃。

オキサゾール (59mg、収率67%) を得た。

実施例167

NーメチルーNー(2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ[2,

1-b] オキサゾールー2-イルメチル) -2- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) エチルアミンの製造

実施例6で製造した2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル) -4-ニトロイミダゾール(84mg、0.39ミリモル)、N-メチルー5 2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)エチルアミン(100mg、0.43ミリモル)及びDMF(1m1)の混合物を65-70℃にて8時間撹拌した。反応液を室温に戻し、水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=2010/1)により精製して黄色油状物質を得た。

この黄色油状物質をDMF1m1に溶解し、水素化ナトリウム(11mg、0.28ミリモル)を加え、室温下にて1時間撹拌した。反応液に氷水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄して硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=10/1)により精製し、塩化メチレンージイソプロピルエーテルより結晶化を行い、白色粉末のNーメチルーNー(2ーメチルー6ーニトロー2、3ージヒドロイミダゾ [2、1ーb] オキサゾールー2ーイルメチル)ー2ー(4ートリフルオロメトキシフェノキシ)エチルアミン(34mg、収率21%)を得た。

20 融点 86.4-89.2℃。

実施例168

N-メチル-N- $\{2-[N-$ メチル-(2-メチル-6-ニト-2, 3-ジ ヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) アミノ] エチル $\}$ カルバミン酸 terton terton terton terton terton

25 2ークロロー4ーニトロー1Hーイミダゾール(5.97g、27.43ミリモル)、Nーメチルー{2ー[Nーメチルー(2ーメチルー2ーオキシラニルメチル)アミノ]エチル}カルバミン酸tertーブチルエステル(10.53g、40.76ミリモル)、トリエチルアミン(0.76ml、5.49ミリモル)及び1ープロパノール(60ml)の混合物を5時間加熱還流した。反応液を室

温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に水を加え、塩化メチレンにより抽出し、 飽和食塩水により洗浄後、硫酸ナトリウムにより乾燥し、濾過した。濾液を減圧 下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/ メタノール=20/1)により精製して黄色油状物質を得た。

- 5 この黄色油状物質を1,4ージオキサン200mlに溶解し、水素化ナトリウム(500mg、12.5ミリモル)を加え、終夜加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に氷水を加え、塩化メチレンにより抽出し、飽和食塩水により洗浄後、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メ10 チレン/メタノール=20/1)により精製し、白色粉末結晶のNーメチルーNー(2-[Nーメチルー(2-メチルー6ーニトロー2,3ージヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールー2ーイルメチル)アミノ]エチル}カルバミン酸tertーブチルエステル(1.94g、収率13%)を得た。

 1 H-NMR(CDCl3)δppm:
- 15 1. 45 (9H, s), 1. 58 (3H, s), 2. 38 (3H, s), 2. 57-2. 69 (3H, m), 2. 79 (3H, s), 2. 89 (1H, d, J=14. 9Hz), 3. 15-3. 25 (2H, bm), 3. 85 (1H, d, J=14. 9Hz), 4. 33 (1H, br), 7. 52 (1H, s)。 実施例169
- 20 (S) -N-メチル-N-(2-メチル-6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダ ゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル) [2-{4-[4-(トリ フルオロメチル) フェニル] ピペラジンー1ーイル} エチル] アミンの製造 実施例12で製造した(R) -2-クロロー1-(2-メチルー2ーオキシラニルメチル) -4-ニトロイミダゾール(523mg、2.41ミリモル)及び N-メチルー2-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル) ピペラジンー1ーイル] エチルアミン(900mg、3.13ミリモル)をDMF15m1に加え、70-80℃にて5時間撹拌した。反応液を室温に戻し、水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化

メチレン/酢酸エチル=20/1)により精製して黄色油状物質を得た。

この黄色油状物質をDMF15mlに溶解し、水素化ナトリウム(115mg、 2.89ミリモル)を加え、室温下で1時間撹拌した。反応液に氷水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、

- 5 濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=10/1)により精製し、塩化メチレンージイソプロピルエーテルより結晶化を行い、白色粉末の(S)ーNーメチルーNー(2ーメチルー6ーニトロー2,3ージヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールー2ーイルメチル)ー2ー[4-(4ートリフルオロメチルフェニ
- 10 ル)ピペラジン-1-イル]エチルアミン(173mg、収率15%)を得た。 MS 468 (M⁺)

融点 148.0-150.5℃。

対応する出発原料を用い、実施例169と同様にして、実施例170~実施例177の化合物を製造した。

15 実施例170

白色粉末、収率12%

20 MS 399 (M-H) + 融点 123.0-126.0℃。

実施例171

- 25 トキシフェノキシ) エチルアミン

白色粉末、収率45%

 $MS 416 (M^{+})$

融点 112.5-115.0℃。

実施例172

(S) -N, N' -ジメチル-N- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) <math>-N' -(4-トリフルオロメチルフェニル) -1, 2-エチレンジアミン

白色粉末、収率24%

 $5 \text{ MS } 413 \text{ (M}^{+})$

融点 135.5-137.5℃。

実施例173

- (S) -4-[2-(N-メチル-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチルアミノ) エチル] ピペラ
- 10 ジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル

白色粉末、収率30%

 $MS 425 (M+H)^{+}$

融点 149.5-151.8℃。

実施例174

白色粉末、収率25%

融点 96.5-97℃。

- 20 実施例175
 - (S) -N-メチル-N- [3-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) プロピル] -2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチルアミン

白色粉末、収率50%

25 融点 92-95℃。

実施例176

白色粉末、収率27%

融点 130.5-132℃。

実施例177

 (S) -N-メチル-N-(2-メチル-6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダ
 5 ゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) -2-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジン-1-イル] エチルアミン 淡茶粉末、収率26%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 58 (3H, s), 1. 70-1. 85 (2H, m), 1. 98 (2H, 10 br), 2. 37 (3H, s), 2. 25-2. 50 (4H, m), 2. 50-2. 80 (5H, m), 2. 90 (1H, d, J=14. 9Hz), 3. 85 (1H, d, J=9. 5Hz), 4. 37 (1H, m), 4. 52 (1H, d, J=14. 9Hz), 7. 42 (2H, d, J=8. 7Hz), 7. 52 (1H, s), 7. 53 (2H, d, J=8. 7Hz),

15 実施例178

N-(2-エトキシカルボニルフェニル)-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチルアミンの製造 2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール(891mg、6.04ミリモル)、1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1H-ベンゾ [d] [1,3] オキサジン-2, 4-ジオン(1.41g、6.04ミリモル)、酢酸ナト 20 リウム (545mg、6.64ミリモル) 及びエタノール (10ml) の混合物 を10時間、加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に 水を加え、塩化メチレンにより抽出し、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウ ムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣を1,4-ジオ キサン20mlに溶解し、水素化ナトリウム (219mg、5.48ミリモル) 25を加え、5時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣 に氷水を加え、析出晶を濾取した。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=20/1) により精製し、白色粉末結晶のN-(2-エトキシカルボニルフェニル) -2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒ

ドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチルアミン(1. 15g、収率55%)を得た。

融点 162.5-163.2℃。

実施例179

5 (S) -1-[2-ヒドロキシ-3-(N-メチルーベンジルアミノ)-2-メチルプロピル]-2-クロロ-4-ニトロイミダゾールの製造

- 15 2ーメチルプロピル] -2-クロロー4ーニトロイミダゾール(712mg、収率91%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 13 (3H, s), 2. 37-2. 57 (5H, m), 3. 51 (1H, d, J=12. 9Hz), 3. 72 (1H, d, J=12. 9Hz), 3. 85 (2

対応する出発原料を用い、実施例179と同様にして、実施例180〜実施例

H, s), 7. 16-7. 39 (5H, m), 7. 87 (1H, s).

実施例180

187の化合物を製造した。

20

- (S) $-1-\{2-ヒドロキシ-3-[N-メチルー(3-クロロベンジル)]$
- 25 アミノー2ーメチル} プロピルー2ークロロー4ーニトロイミダゾール 収率98%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 15 (3H, s), 2. 35-2. 57 (5H, m), 3. 53 (1H, d, J=13. 3Hz), 3. 67 (1H, d, J=13. 3Hz), 3. 92 (2

- H, s), 7. 10-7. 31 (4H, m), 7. 95 (1H, s)。 実施例181
- (S) $-1-\{2-$ ビドロキシ-3-(N-メチル-4-クロロベンジルアミノ) -2-メチルプロピル] -2-クロロ-4-ニトロイミダゾール
- 5 収率86%

 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1. 13 (3H, s), 2. 33-2. 59 (5H, m), 3. 53 (1H, d, J=13. 2Hz), 3. 68 (1H, d, J=13. 2Hz), 3. 92 (2H, s), 7. 19 (2H, d, J=8. 4Hz), 7. 31 (2H, d, J=

10 8.4 Hz), 7.96 (1H, s).

実施例182

- 15 収率98%

 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1. 13 (3H, s), 2. 37 (3H, s), 2. 47 (1H, d, J=13. 9Hz), 2. 58 (1H, d, J=13. 9Hz), 3. 58 (1H, d, J=13. 3Hz), 3. 72 (1H, d, J=13. 3Hz), 3. 94 (2H,

20 s), 7. 19 (2H, d, J=8. 6Hz), 7. 31 (2H, d, J=8. 6Hz), 7. 99 (1H, s).

実施例183

- (S) -1-[2-ヒドロキシ-3-(N-メチル-4-トリフルオロメチルベンジルアミノ) <math>-2-メチルプロピル] -2-クロロー4-ニトロイミダゾール
- 25 収率100%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 15 (3H, s), 2. 38 (3H, s), 2. 50 (1H, d, J=13. 9Hz), 2. 60 (1H, d, J=13. 9Hz), 3. 65 (1H, d, J=13. 6Hz), 3. 79 (1H, d, J=13. 6Hz), 3. 97 (2H, s), 7. 41 (2H, d, J=8. 2Hz), 7. 61 (2H, d, J=8. 2Hz), 8. 00 (1H, s).

実施例184

- (S) -1-[2-ヒドロキシ-3-(N-メチル-4-メトキシベンジルアミ
- 5 ノ) -2-メチルプロピル] -2-クロロ-4-ニトロイミダゾール 収率85%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 12 (3H, s), 2. 36-2. 50 (5H, m), 3. 45 (1H, d, J=12. 8Hz), 3. 64 (1H, d, J=12. 8Hz), 3. 80 (3

10 H, s), 3.84 (2H, s), 6.84 (2H, dd, J=1.9Hz, 8.6Hz), 7.13 (2H, dd, J=1.9Hz, 8.6Hz), 7.89 (1H, s).

実施例185

- (S) -1-[2-ヒドロキシ-3-(N-メチル-4-ジメチルアミノベンジ
- 15 ルアミノ) -2-メチルプロピル] -2-クロロ-4-ニトロイミダゾール 収率94%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

- 1. 11 (3H, s), 2. 34-2. 47 (5H, m), 2. 93 (s, 6 H), 3. 39 (1H, d, J=12. 8Hz), 3. 60 (1H, d, J=1
- 20 2.8Hz), 3.81 (2H, s), 6.65 (2H, d, J=8.7Hz), 7.03 (2H, d, J=8.7Hz), 7.87 (1H, s)。 寒施例186

(S) -1-[2-ヒドロキシ-3-(N-メチルーフェニルアミノ)-2-メチルプロピル]-2-クロロー4-ニトロイミダゾール

25 収率92%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

- 1. 24 (3H, s), 3. 06 (3H, s), 3. 40 (2H, s), 4. 0
- 5 (1H, d, J = 14.2Hz), 4.13 (1H, d, J = 14.2Hz),
- 6. 74-6. 89 (3H, m), 7. 17-7. 34 (2H, m), 8. 04

(1H, s).

実施例187

- (S) $-1-\{2-ヒドロキシ-3-(N-メチル-4-クロロフェニルアミノ) -2-メチルプロピル] -2-クロロー4-ニトロイミダゾール$
- 5 収率92%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 24 (3H, s), 3. 04 (3H, s), 3. 38 (2H, s), 4. 08 (2H, s), 6. 74 (2H, dd, J=2. 1Hz, 7. 2Hz), 7. 19 (2H, dd, J=2. 1Hz, 7. 2Hz), 8. 02 (1H, s).

10 実施例188

(S) -2-(N-ベンジル-N-メチル) アミノメチルー2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造

実施例179で製造した(S)-1- [2-ヒドロキシー3- (N-メチルーベンジルアミノ)-2-メチルプロピル]-2-クロロー4-ニトロイミダゾー

- 15 ル (710mg、2.1ミリモル)及びDMF (2.1ml)の混合物に、氷冷下にて水素化ナトリウム (101mg、2.51ミリモル)を加え、同温度下にて2時間撹拌した。反応液に酢酸エチル0.7ml、水5mlの順に加え、析出晶を濾取した。これをイソプロピルアルコール10ml中に加熱還流下にて溶解し、活性炭28mgを加え、20分加熱還流を続けた。熱時濾過後、濾液にイソ
- 20 プロピルエーテル 3m1 を加え、静置し、析出晶を濾取することにより、黄色粉末結晶晶の(S)-2-(N-ベンジル-N-メチル)アミノメチル-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール(24 8mg、収率 39%)を得た。

融点 132.5-133℃。

25 対応する出発原料を用い、実施例188と同様にして、実施例189〜実施例 196の化合物を製造した。

実施例189

収率44%、融点 129-129.5℃。

実施例190

実施例191

- (S) -2-[N-(4-h)]フルオロメトキシベンジル)-N-メチルアミノ] メチル-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール
- 10 収率53%、融点 145-146℃。

実施例192

- 15 収率49%、融点 130-132℃。

実施例193

- (S) -2-[N-(4-メトキシベンジル)-N-メチルアミノ] メチル<math>-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール収率59%、融点 144-147%。
- 20 実施例194

収率47%、融点168-169℃。

- 25 実施例195
 - (S) -2-(N-フェニル-N-メチルアミノ) メチル-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール 収率5.5%、融点 1.4.7-1.4.8%。

実施例196

実施例197

5 (S) -4-[2-(N-メチル-2-メチル-6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチルアミノ) エチル] ピペラジン-1-カルボン酸4-トリフルオロメチルベンジルエステルの製造

実施例173で製造した(S)-4-[2-(N-メチル-2-メチル-6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー<math>2-イルメチ

- 10 ルアミノ) エチル] ピペラジン-1-カルボン酸 tertーブチルエステル (3 00mg、0.71ミリモル) を塩化メチレン5mlに溶解し、トリフルオロ酢酸5mlを加え、3時間室温で撹拌した。反応液を減圧下濃縮し、塩化メチレン及びトリエチルアミンを2mlずつ加えた。室温下、5分撹拌した後、減圧下濃縮し、残渣をDMF15mlに溶解した。そこへ4-トリフルオロメチルベンジ
- 15 ルアルコール(373mg、2.12ミリモル)及び1,1'ーカルボニルジイミダゾール(344mg、2.12ミリモル)をDMF5mlに溶解し3時間室温で撹拌した混合物を加え、室温で1時間撹拌した。反応液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出後、有機相を飽和食塩水で洗浄した。硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマト
- 20 グラフィー(塩化メチレン/メタノール=50/1)により分離精製した。塩化メチレンーイソプロピルエーテルより結晶化を行い、濾取後、減圧乾燥することにより、白色粉末の(S)-4-[2-(N-メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチルアミノ)エチル]ピペラジン-1-カルボン酸<math>4-トリフルオロメチルベンジルエス
- 25 テル (196mg、収率53%) を得た。

MS = 509 (M-H2O) +

融点 77.2-76.9℃。

実施例198

(S) -N-メチル-N-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダ

y[2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル) -2-[4-(4-h)] オロメチルベンジル) ピペラジン1-イル] エチルアミンの製造

実施例173で製造した(S)-4-[2-(N-メチル-2-メチル-6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2-イルメチ ルアミノ) エチル] ピペラジンー1ーカルボン酸tert-ブチルエステル (4 00mg、0.94ミリモル) を塩化メチレン5mlに溶解し、トリフルオロ酢 酸5m1を加え、5時間室温で撹拌した。反応液を減圧下濃縮し、塩化メチレン 及びトリエチルアミンを2mlずつ加えた。室温下、5分撹拌した後、減圧下濃 縮した。残渣をメタノール10m1に溶解し、4-(トリフルオロメチル)ベン ズアルデヒド (0.4m1、2.83ミリモル)、シアノトリヒドロホウ酸ナト リウム (178mg、2.83ミリモル) 及び酢酸0.2mlを加え、室温で3 0分撹拌した。飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び塩化メチレンを加え、撹拌し て、塩化メチレンで抽出した。有機相を硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。 得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ ー(塩化メチレン/メタノール=200/1)により分離精製した。塩化メチレ 15 ンーイソプロピルエーテルより結晶化を行い、濾取後減圧乾燥することにより、 白色粉末の(S)-N-メチル-N-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒ ドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー 2 - 4 - 4 - 4ートリフルオロメチルベンジル) ピペラジン1ーイル] エチルアミン (307

·20 mg、収率68%)を得た。

 $MS 482 (M^{+})$

融点102.0-104.5℃。

実施例199

(6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イ 25 ルメチル) カルバミン酸エチルエステルの製造

2, 4-ジニトロ-1H-イミダゾール (0.678g、3.92ミリモル) 及び2-オキシラニルメチルカルバミン酸フェニルエステル (1.04g、5.87ミリモル) をエタノール20mlに溶解し、酢酸ナトリウム (0.386g、4.70ミリモル) を加え、終夜加熱還流した。飽和炭酸水素ナトリウム水溶液

及び塩化メチレンを加えて抽出した。硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過後、濾液を減圧濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=50/1)で精製し、ジイソプロピルエーテルを加えた。析出物を濾取後、減圧乾燥することにより、微茶色固体の(6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル)カルバミン酸エチルエステル(0.116g、収率11.6%)を得た。

 $^{1}H-NMR$ (DMSO-d₆) δ p p m:

1. 15 (3H, t, J=7. 1Hz), 3. 41-3. 51 (2H, m), 3. 93-4. 11 (3H, m), 4. 38 (1H, dd, J=8. 6Hz, 10.

10 7 Hz), 5. 31-5. 47 (1 H, m), 7. 52 (1 H, br), 8. 1 3 (1 H, s).

実施例200

(2-メチルー6-ニトロー2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾ ールー2-イルメチル)カルバミン酸ベンジルエステルの製造

- 2,4ージニトロー1Hーイミダゾール(3g、19ミリモル)及び(2ーメチルー2ーオキシラニルメチル)カルバミン酸ベンジルエステル(4.31g、19ミリモル)をエタノール(20ml)に溶解し、酢酸ナトリウム(1.56g、19.0ミリモル)を加え、70℃で撹拌終夜した。飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び塩化メチレンを加えて抽出した。硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過後、
- 20 濾液を減圧濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n ーへキサン/酢酸エチル=1/1、塩化メチレン/メタノール=50/1) で精製し酢酸エチルー塩化メチレンから再結晶することにより、無色固体の (2-メチルー6ーニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル) カルバミン酸ベンジルエステル (0.298g、収率4.7%)
- 25 を得た。

融点 171.3-172.2℃

 1 H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

1. 55 (3H, s), 3. 46 (2H, d, J=6. 3Hz), 4. 06 (1 H, d, J=11. 0Hz), 4. 25 (1H, d, J=11. 0Hz), 5.

03 (2H, s), 7. 19-7. 41 (5H, m), 7. 76 (1H, t, J = 6. 3Hz), 8. 13 (1H, s).

実施例201

2-メチルー6-ニトロー2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾー 5 ルー2-イルメチルアミン・トリフルオロ酢酸塩の製造

実施例200で製造した(2-メチルー6-ニトロー2,3-ジヒドロイミダン[2,1-b]オキサゾールー2ーイルメチル)カルバミン酸ベンジルエステル(190mg、0.57ミリモル)、トリフルオロ酢酸(4ml)及び塩化メチレン(5ml)の混合物を室温下にて終夜撹拌した。反応液を減圧下にて濃縮した。残渣にジエチルエーテルを加え、析出晶を濾取することにより、微黄色粉末の2-メチルー6。これで、0.00、ジャル・インジェラース

10 した。残渣にジエチルエーテルを加え、析出晶を濾取することにより、微黄色粉末の2-メチルー6-ニトロー2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールー2-イルメチルアミン・トリフルオロ酢酸塩(120mg、収率67%)を得た。

 1 H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

15 1. 35 (3H, s), 3. 23 (1H, d, J=9.6Hz), 3. 49 (1 H, d, J=9.6Hz), 3. 82-3. 98 (2H, m), 7. 98 (1H, s), 12. 22 (1H, s).

対応する出発原料を用い、実施例200と同様にして、実施例202〜実施例204の化合物を製造した。

20 実施例202

Nーメチルー (2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2-イルメチル)カルバミン酸ベンジルエステル 収率14%、融点 150.3-151.6%。

実施例203

25 (6-二トロー2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールー2ーイルメチル)カルバミン酸ベンジルエステル

収率11%

 1 H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

3. 45-3. 59 (2H, m), 4. 07 (1H, dd, J=6. 6Hz, 1

0. 8 Hz), 4. 39 (1H, dd, J = 8.6 Hz, 10.8 Hz), 5. 04 (2H, s), 5. 32-5.50 (1H, m), 7. 23-7.41 (5H, m), 7. 71 (1H, br), 8. 13 (1H, s).

実施例204

5 (6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル)カルバミン酸tertーブチルエステル収率27%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 43 (9H, s), 3. 65 (2H, dd, J=4. 3Hz, 6. 2Hz),

10 4. 20 (1H, dd, 7. 0Hz, 10. 5Hz), 4. 36 (1H, dd, J=8. 6Hz, 10. 5Hz), 5. 20 (1H, t, J=6. 2Hz), 5. 35-5. 48 (1H, m), 7. 56 (1H, s).

実施例205

15

(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾ ール-2-イルメチル)カルバミン酸4-クロロベンジルエステルの製造

2,4-ジニトロ-1H-イミダゾール(0.518g、3.28ミリモル) 及び(2-メチル-2-オキシラニルメチル)カルバミン酸4-クロロベンジル エステル(2.097g、8.20ミリモル)を混合し、室温で撹拌終夜した。 反応液にエタノール6mlを加え、酢酸ナトリウム(0.538g、6.56ミ

- 20 リモル)を加え1時間加熱還流した。これに水を加え、析出物を濾取した。得られた固体をジエチルエーテル洗浄後、減圧乾燥することにより、無色固体の(2 ーメチルー6ーニトロー2,3ージヒドロイミダゾ[2,1ーb]オキサゾールー2ーイルメチル)カルバミン酸4ークロロベンジルエステル(0.197g、収率16%)を得た。
- 25 融点 221.0-221.8℃。

実施例202で製造したN-メチルー(2-メチルー6-ニトロー2,3-ジ ヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾールー2ーイルメチル)カルバミン酸ベ ンジルエステルを用い、実施例201と同様にして、実施例206の化合物を製 造した。 実施例206

Nーメチルー2ーメチルー6ーニトロー2, 3ージヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチルアミン・トリフルオロ酢酸塩 融点 176.2-178.8 $^{\circ}$ 。

5 対応する出発原料を用い、実施例205と同様にして、実施例207~実施例211の化合物を製造した。

実施例207

(2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾ ールー2-イルメチル) カルバミン酸4-フルオロベンジルエステル

10 収率25%、融点 200.4-202.1℃。

実施例208

(2-メチルー6-ニトロー2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾ ールー2-イルメチル)カルバミン酸エチルエステル

収率26%、融点 182.5-183.4℃。

15 実施例209

(2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾ ールー2ーイルメチル) カルバミン酸4-トリフルオロメトキシベンジルエステ ル

収率17%、融点 182.3-184.4℃。

20 実施例210

(6-二トロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2-イルメチル) カルバミン酸4-クロロベンジルエステル

収率17%、融点 182.6-182.9℃。

実施例211

25 (6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2-イ ルメチル) カルバミン酸4-フルオロベンジルエステル

収率17%、融点 164.6-165.1℃。

実施例212

[3-(2-クロロー4-ニトロイミダゾールー1-イル) -2-ヒドロキシー

2-メチルプロピル]-N-メチルーカルバミン酸4-フルオロベンジルエステルの製造

2-クロロー4-ニトロー1H-イミダゾール (0.953g、6.46ミリモル)及びN-メチルー (2-メチルー2-オキシラニルメチル)カルバミン酸 4-フルオロベンジルエステル (1.964g、7.75ミリモル)をエタノール20m1に溶解し、酢酸ナトリウム (0.583g、7.11ミリモル)を加え、終夜加熱還流した。エタノールを減圧濃縮し、残渣に酢酸エチル及び水を加えて抽出した。硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過後、濾液を減圧濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=1

10 / 1) で精製することにより、無色油状物の [3-(2-クロロー4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-ヒドロキシー2-メチルプロピル] -N-メチルーカルバミン酸4-フルオロベンジルエステル(1.683g、収率65%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

15 1. 17 (3H, s), 3. 06 (3H, s), 3. 25 (1H, d, J=14. 7Hz), 3. 51 (1H, d, J=14. 7Hz), 4. 00 (2H, s), 5. 12 (2H, s), 6. 95-7. 09 (2H, m), 7. 27-7. 41 (2H, m), 8. 07 (1H, s).

N-メチルー(2-オキシラニルメチル)カルバミン酸4-フルオローベンジ 20 ルエステルを用い、実施例212と同様にして、実施例213の化合物を製造した。

実施例213

[3-(2-クロロー4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシプロピル]-N-メチルーカルバミン酸4-フルオロベンジルエステル

25 収率51%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

3. 04 (3H, s), 3. 27-3. 55 (2H, m), 3. 73-4. 23 (4H, m), 5. 11 (2H, s), 7. 00-7. 14 (2H, m), 7. 27-7. 41 (2H, m), 7. 96 (1H, s).

実施例214

10

15

20

N-メチル-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル)カルバミン酸 <math>4-フルオロベンジルエステルの製造

5 実施例212で製造した [3-(2-クロロー4-ニトロイミダゾールー1-イル) -2-ヒドロキシー2-メチルプロピル] -N-メチルーカルバミン酸4-フルオロベンジルエステル(1.683g、4.20ミリモル)を1,4-ジオキサン30mlに溶解し、水素化ナトリウム(0.185g、4.62ミリモル)を加え、1時間室温で撹拌した後、7時間加熱還流した。溶媒を減圧留去し、

残渣に水を加え析出物を濾取した。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー $(n-\wedge + \psi)/r$ セトン= 2/1)で精製した。得られた固体を $n-\wedge + \psi$ ン 及び酢酸エチルの混合溶媒で洗浄し、濾取後、減圧乾燥することにより、無色固体のN-メチルー(2-メチルー6-ニトロー2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾールー2-イルメチル)カルバミン酸4-フルオロベンジルエステル(0. 381g、収率25%)を得た。

融点 168.9-169.9℃。

実施例213で製造した[3-(2-クロロー4ーニトロイミダゾールー1ーイル) -2-ヒドロキシプロピル] -N-メチルーカルバミン酸4ーフルオロベンジルエステルを用い、実施例214と同様にして、実施例215の化合物を製造した。

実施例215

N-メチル-(6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル)カルバミン酸4ーフルオロベンジルエステル $収率16%、融点 124.5-128.1<math>^{\circ}$ C。

25 対応する出発原料を用い、実施例179と同様にして、実施例216~実施例220の化合物を製造した。

実施例216

(S) $-1-(2-\rho u u - 4- = h u d = f y y - h - 1 - d h) - 3 - { [1 - (4-\rho u u z = h) ピペリジン-4- d h] - N - メチルーアミノ} - 2$

ーヒドロキシー2ーメチルプロパン

黄色油状物、収率98%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 13 (3H, s), 1. 57-1. 82 (4H, m), 2. 38-2. 71
5 (4H, m), 2. 40 (3H, m), 3. 65-3. 71 (2H, m), 3. 82 (1H, s), 3. 89-4. 01 (2H, m), 6. 81-6. 86 (2H, m), 7. 16-7. 22 (2H, m), 8. 06 (1H, s).

実施例217

(S) $-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -3-{[1}$

10 -(4-)リフルオロメトキシフェニル)ピペリジン-4-イル]-N-メチルーアミノ $\}-2-$ ヒドロキシー2-メチルプロパン

黄色油状物、収率91%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 13 (3H, s), 1. 59-1. 83 (4H, m), 2. 41 (3H,

15 s), 2. 43-2. 73 (5H, m), 3. 66-3. 73 (2H, m), 3. 84 (1H, s), 3. 93 (1H, d, J=14. 2Hz), 4. 00 (1H, d, J=14. 2Hz), 6. 86-6. 91 (2H, m), 7. 07-7. 1 2 (2H, m), 8. 06 (1H, s).

実施例218

黄色油状物、収率96%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

25 1. 13 (3H, s), 1. 54-1. 70 (2H, m), 1. 77-1. 84
(2H, m), 2. 40 (3H, s), 2. 42-2. 60 (3H, m), 2.
72-2. 82 (2H, m), 3. 79 (1H, s), 3. 84-3. 89 (2H, m), 3. 92 (1H, d, J=14. 2Hz), 3. 99 (1H, d, J=14. 2Hz), 6. 91 (2H, d, J=8. 7Hz), 7. 46 (2H,

d, J = 8.7 Hz), 8.06 (1H, s).

実施例219

- (4-シアノフェニル)ピペリジン-4-イル]-N-メチルーアミノ}-2
- 5 ーヒドロキシー2ーメチルプロパン

黄色油状物、収率89%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 13 (3H, s), 1. 51-1. 65 (2H, m), 1. 77-1. 84 (2H, m), 2. 39 (3H, s), 2. 42-2. 62 (3H, m), 2.

10 76-2.88 (2H, m), 3.75 (1H, s), 3.88-4.03 (4 H, m), 6.81-6.88 (2H, m), 7.45-7.53 (2H, m), 8.05 (1H, s).

実施例220

(S) $-1 - (2 - \rho \alpha \alpha - 4 - \alpha + \alpha + 2 \beta \gamma - \gamma - 1 - 4 \gamma$

15 -(tert-ブトキシカルボニル) ピペリジン<math>-4-イル] -N-メチルーア = 2 + 2 + 2 + 2 + 3 + 4

黄色油状物、

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 11 (3H, s), 1. 46 (9H, s), 1. 50-1. 80 (4H,

20 m), 2. 37 (3H, s), 2. 40-2. 75 (5H, m), 3. 90 (1 H, d, J=14. 2Hz), 3. 99 (1H, d, J=14. 2Hz), 4. 22 (2H, br), 8. 05 (1H, s).

実施例216~実施例220で製造した化合物から、実施例188と同様にして、実施例221~実施例225の化合物を製造した。

25 実施例 2 2 1

白色粉末、収率47%

 $MS = 406 (M+1)^{+}$

融点 179.2-182.1℃。

実施例222

(S) $-2-\{[1-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペリジン<math>-4-$

5 イル] $-N-メチル-アミノメチル} - 2-メチル-6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール$

融点 127.2-129.7℃。

実施例223

(S) $-2-\{[1-(4-トリフルオロメチルフェニル) ピペリジン-4-イ$

10 ル] -N-メチル-アミノメチル $\}$ -2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

融点 131.5-133.6℃。

実施例224

(S) $-2-\{[1-(4-シアノフェニル) ピペリジン<math>-4-4$ ル] -N-メ

15 チルーアミノメチル} -2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

融点 149-152℃。

実施例225

(S) $-2-\{[1-(tert-ブトキシカルボニル) ピペリジン-4-イ$

20 ν $N-\lambda + \nu - \nu = 1$ $N-\lambda + \nu - \nu = 1$ $N-\lambda + \nu = 1$

淡黄色粉末晶、収率37%

融点 138.5-140.3℃。

実施例226

25 (S) $-2-\{[1-(4-h)]$ (T) -2-y (S) $-2-\{[1-(4-h)]$ (P) -2-y (P) -2-y

実施例225で製造した $(S)-2-\{[1-(tert-ブトキシカルボニル) ピペリジン<math>-4-1$ ル] $-N-メチル-アミノメチル \}-2-メチル-6-$

ニトロー2、3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール(400mg、 1.01ミリモル)を塩化メチレン1mlに溶解し、これにトリフルオロ酢酸1 m1を加え5時間室温で撹拌した。反応液を減圧下濃縮し、塩化メチレン及びト リエチルアミン1m1ずつを加えた。これを室温で5分撹拌した後、減圧下濃縮 し、残渣をDMF8mlに溶解した。そこへ4-(トリフルオロメチル)ベンジ ルアルコール(267mg、1.51ミリモル)及び1,1'ーカルボニルジイ ミダゾール(246mg、1.51ミリモル)をDMF2mlに溶解し4時間室 温で撹拌した混合物を加え、室温で終夜撹拌した。反応液を水に注ぎ、酢酸エチ ルで抽出後、有機相を飽和食塩水で洗浄した。硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過 した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグ 10 ラフィー(塩化メチレン/メタノール=200/1)により分離精製した。塩化 メチレンーイソプロピルエーテルより結晶化を行い、濾取後減圧乾燥することに より、微黄色粉末の(S) $-2-\{[1-(4-トリフルオロメチルベンジルオ$ キシカルボニル) ピペリジンー4ーイル] -N-メチル-アミノメチル} -2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール 15 (341mg、収率68%)を得た。

融点 110.6-113.1℃。

対応する出発原料を用い、実施例226と同様にして、実施例227及び実施例228の化合物を製造した。

20 実施例227

25 実施例 2 2 8

実施例229

2-メチルー6-ニトロー2- [4-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシ)ピペリジン-1-イルメチル]-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b]オキサゾールの製造

実施例6で製造した2-クロロー1-(2-メチルー2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール(122mg、0.56ミリモル)及び4-[4-(トリフルオロメチル)ベンジルオキシ]ピペリジン(188mg、4.86モル)をDMF10m1に溶解し、70-75℃にて5時間撹拌した。反応液を室温に戻し水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=50/1)により精製し黄色油状物質を得た。

この黄色油状物質をDMF10mlに溶解し、氷冷下水素化ナトリウム(134mg、3.36ミリモル)を加え、室温まで昇温させ1時間撹拌した。反応液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=10/1)により精製し、酢酸エチルージイソプロピルエーテルより結晶化を行い、白色粉末の2ーメチルー6ーニトロー2ー[4ー(4ートリフルオロメチルベンジルオキシ)ピペリジンー201ーイルメチル]-2,3ージヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(41mg、収率17%)を得た。

 $MS 440 (M-1)^{+}$

 1 H-NMR (CDC1₃) δ ppm:

1. 45-1. 70 (2H, m), 1. 60 (3H, s), 1. 75-1. 88

25 (2H, m), 2. 26-2. 40 (1H, m), 2. 45-2. 55 (2H, m), 2. 72-2. 95 (3H, m), 3. 38 (1H, m), 3. 89 (1H, d, J=9. 6Hz), 4. 31 (1H, d, J=9. 6Hz), 4. 54 (2H, s), 7. 43 (2H, d, J=8. 2Hz), 7. 53 (1H, s), 7. 79 (2H, d, J=8. 2Hz),

実施例230

1-(2-クロロー4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-3-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル]プロパン-2-オールの製造

- 実施例5で製造した2-クロロ-1-[2-ヒドロキシ-2-メチル-3-(4-メチルベンゼンスルホニルオキシ)プロピル]-4-ニトロイミダゾール(0.30g、0.77ミリモル)及び4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン(0.21g、0.85ミリモル)のDMF(6m1)溶液にヨウ化ナトリウム(0.13g、0.77ミリモル)及びトリエチルアミン(0.
- 10 12m1、0.77ミリモル)を加え、80℃で7時間撹拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出し、水で洗浄して硫酸マグネシムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=9/1)により精製し、黄色油状物の1-(2-クロロ-4-=トロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-3-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキ
- 15 シ) ピペリジン-1-イル] プロパン-2-オール (0.23g、収率63%) を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 14 (3H, s), 1. 76-2. 04 (4H, m), 2. 36 (1H, d, J=14. 0Hz), 2. 43-2. 72 (3H, m), 2. 76-3. 00

20 (2H, m), 3. 46-3. 52 (1H, br), 3. 98 (2H, s), 4. 37-4. 50 (1H, m), 6. 91-7. 00 (2H, m), 7. 48-7. 61 (2H, m), 8. 05 (1H, s).

対応する出発原料を用い、実施例230と同様にして、実施例231の化合物を製造した。

25 実施例231

 $1-(2-\rho - \mu - 4-\mu - 1-\mu - 1-$

収率61%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 14 (3H, s), 1. 74-2. 04 (4H, m), 2. 35 (1H, d, J=13. 9Hz), 2. 40 (1H, d, J=13. 9Hz), 2. 43-2. 70 (2H, m), 2. 74-3. 00 (2H, m), 3. 98 (2H, s),

5 4. 25-4. 41 (1H, m), 6. 86-6. 92 (2H, m), 7. 11 -7. 15 (2H, m), 8. 05 (1H, s).

実施例232

10

20

た。

 $1-(2-\rho$ ロロー4ーニトロイミダゾールー1-イル)-2-メチルー3-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ)ピペリジンー1-イル]プロパンー2-オールの製造

実施例 6 で製造した 2-クロロ-1- (2-メチル-2-オキシラニルメチル) -4-ニトロイミダゾール $(0.3 g \ 1.38$ ミリモル) 及びピペリジン -4-イルー (4-トリフルオロメトキシフェニル) アミン $(0.43 g \ 1.66$ ミリモル) のDMF (8 m 1) 溶液を 80 で 2 時間撹拌した。反応液に水

- 15 を加え、酢酸エチルで抽出して硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(nーヘキサン/酢酸エチル=1/1)により精製し、黄色油状物の1-(2-クロロー4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-3-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ)ピペリジン-1-イル]プロパン-2-オール(0.37g、収率56%)を得
 - ¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 13 (3H, s), 1. 39-1. 63 (2H, m), 1. 96-2. 09 (2H, m), 2. 47 (1H, d, J=13.9Hz), 2. 43-2. 63 (3H, m), 2. 67-2. 83 (1H, m), 2. 87-3. 02 (1H,

25 m), 3. 15-3. 39 (1H, m), 3. 41-3. 72 (2H, m), 3. 97 (2H, s), 6. 46-6. 59 (2H, m), 6. 96-7. 09 (2 H, m), 8. 05 (1H, s).

実施例233

2-メチルー6-ニトロー2-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピ

ペリジン-1-イルメチル] -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造

実施例230で製造した1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-3-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル]プロパン-2-オール(225mg、0.49ミリモル)のDMF(2.5ml)溶液に氷冷撹拌下、水素化ナトリウム(23mg、0.59ミリモル)を加え、0℃で1時間撹拌した。これに氷水及び酢酸エチルを加え、析出物を濾取し、水で洗浄し、塩化メチレン及びジイソプロピルエーテルから再結晶し、n-ヘキサンで洗浄し、微黄色固体の2-メチル-6-ニトロ-2-[410-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イルメチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(80mg、収率39%)を得た。

融点 113-114℃。

対応する出発原料を用い、実施例233と同様にして、実施例234の化合物 15 を製造した。

実施例234

2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン-1-イルメチル] -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

20 融点 117-119℃。

実施例235

2-[4-(4-h)]フルオロメトキシフェニル)アミノピペリジン-1-dル]メチル-2-メチル-6-ニトロ-2、3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b]オキサゾールの製造

25 実施例233で製造した1-(2-クロロー4-ニトローイミダゾールー1ーイル) -2-メチルー3-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ)ピペリジン-1-イル]プロパン-2-オール(369mg、0.77ミリモル)を用い、実施例232と同様にして、黄色粉末の2-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ)ピペリジン-1-イル]メチル-2-メチル-6

ーニトロー2, 3 -ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール $(25 \,\mathrm{mg}, \sqrt{25 \,\mathrm{mg}})$ を得た。

 $MS 441 (M^{+})$

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

- 5 1. 11-1. 40 (2H, m), 1. 61 (3H, s), 1. 85-2. 01 (2H, m), 2. 37 (1H, dt, J=2. 7Hz, 11. 4Hz), 2. 46-2. 59 (2H, m), 2. 76-2. 84 (1H, m), 2. 87 (1H, d, J=14. 9Hz), 2. 95-3. 03 (1H, m), 3. 10-3. 25 (1H, m), 3. 50 (1H, d, J=7. 8Hz), 3. 90 (1H,
- 10 d, J=9.7Hz), 4.29 (1H, d, J=9.7Hz), 6.46-6. 52 (2H, m), 6.98-7.01 (2H, m), 7.50 (1H, s)。 実施例236

N-メチルー $\begin{bmatrix} 1-(2-$ メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ $\begin{bmatrix} 2, \\ 1-b \end{bmatrix}$ オキサゾールー2-イルメチル)ピペリジンー4-イル $\end{bmatrix}$ カルバミン酸

15 tertーブチルエステルの製造

20

 $2-\rho$ ロロー4ーニトロー1 Hーイミダゾール(1.08 g、7.31 ミリモル)、Nーメチルー [1-(2-メチルー2-オキシラニルメチル)ピペリジンー4-イル] カルバミン酸 tertーブチルエステル(2.08 g、7.31 ミリモル)、及び酢酸ナトリウム(660 m g、8.04 ミリモル)を1-プロパノール15 m 1 中にて終夜加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、塩化メチレンで

抽出し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=200/1)で精製して塩化メチレンーイソプロピルエーテルにて結晶化を行い、濾取後減圧乾燥することにより、白色粉末のNーメチルー[1-(2-メチ

25 ルー6ーニトロー2, 3ージヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル)ピペリジンー4ーイル] カルバミン酸 tert t

 $MS = 396 (M+1)^{+}$

融点 198.8-201.1℃。

実施例237

N-メチルー $\begin{bmatrix}1-(2-$ メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ $\begin{bmatrix}2$, 1-b $\end{bmatrix}$ オキサゾールー2-イルメチル)ピペリジンー4-イル $\end{bmatrix}$ カルバミン酸 ベンジルエステルの製造

- 5 実施例236で製造したN-メチルー{1-(2-メチルー6-ニトロー2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールー2ーイルメチル)ピペリジンー4ーイル}カルバミン酸tertーブチルエステル(207mg、0.52ミリモル)を塩化メチレン5mlに溶解し、トリフルオロ酢酸5mlを加え、5時間室温で撹拌した。反応液を減圧下濃縮し、残渣に塩化メチレン5ml、トリ
- 10 エチルアミン1ml及びクロロ炭酸ベンジル(0.15ml、1.05ミリモル)を加え、30分室温で撹拌した。反応液を水に注ぎ、塩化メチレンで抽出し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=200/1)により分離精製した。酢酸エチルーイソプロピルエーテルより結晶化を行
- 15 い、濾取後減圧乾燥することにより、白色粉末のN-メチルー [1-(2-メチルー6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペリジン-4-イル]カルバミン酸ベンジルエステル(184mg、収率82%)を得た。

 $MS 430 (M+H)^{+}$

20 融点 138.7-139.2℃。

クロロ炭酸4-クロロベンジルを用い、実施例237と同様にして、実施例238の化合物を製造した。また、4-クロロフェニルアセチルクロリドを用い、 実施例237と同様にして、実施例239の化合物を製造した。

実施例238

N-メチルー $\begin{bmatrix} 1-(2-$ メチルー6-ニトロー2,3-ジヒドロイミダゾ $\begin{bmatrix} 2,1-b \end{bmatrix}$ オキサゾールー2-イルメチル)ピペリジンー4-イル $\end{bmatrix}$ カルバミン酸 4-クロロベンジルエステル

融点 147.2-149.2℃。

実施例239

融点 206.8-208℃。

5 実施例240

2-メチルー2- $\{4-[N-$ メチルーN- (4-トリフルオロメトキシフェニル)] アミノピペリジンー1-イル $\}$ メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造

- 15 42ミリモル)を加え、室温で1時間撹拌した。更にこの反応液を氷冷し、炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、塩化メチレンで抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=1/1)により精製し、ジイソプロピルエーテルで結晶化させ、微黄色固体の2-メチル-2-{4-[N-メチル-N-(4-トリフルオロメ
- 20 トキシフェニル)] アミノピペリジンー1ーイル} メチルー6ーニトロー2, 3ージヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール(40mg、収率65%)を得た。

融点 135-136℃。

実施例241

25 $2-[4-(4-\rho uu べンジル)]$ オキシピペリジン-1-イル] メチル-2-メチル-6-ニトu-2, 3-ジヒドuイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造

2-クロロー4-ニトロー1 H-イミダゾール(1.5 g、1 0.1 7 ミリモル)、4-(4-クロロベンジルオキシ)-1-(2-メチル-2-オキシラニ

ルメチル)ピペリジン(2.5g、8.45ミリモル)、炭酸水素ナトリウム (0.86g、10.24ミリモル)及びエタノール(15ml)の混合物を1 5時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に水を加 え、塩化メチレンにより抽出し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、減圧濃縮し た。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル= 10/1)により精製し、白色粉末の2-[4-(4-クロロベンジル)オキシ ピペリジン-1-イル]メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイ ミダゾ [2,1-b]オキサゾール(662mg、収率16%)を得た。 融点 129-130℃。

10 実施例242

 $2-\{4-[N-(4-クロロフェニル)-N-メチル]$ アミノピペリジン-1-イル $\}$ メチル-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾールの製造

実施例6で製造した2-クロロ-1- (2-メチルオキシラニルメチル) -4
15 -ニトロイミダゾール (350mg、1.61ミリモル)、4- [N-(4-クロコフェニル)-N-メチルアミノ] ピペリジン (373mg、1.66ミリモル) 及びDMF (15m1) の混合物を70℃にて5時間撹拌した。この反応液に氷冷下にて水素化ナトリウム77mg (1.93ミリモル)を加え、同温度下にて1時間撹拌した。反応液を氷水中に注ぎ、酢酸エチルにより2回抽出した。

20 有機相を合わせ、3回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより 乾燥した後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化 メチレン/酢酸エチル=1/1)により精製し、微黄色粉末結晶の2-{4-[N-(4-クロロフェニル)-N-メチル]アミノピペリジン-1-イル}メ チルー2-メチルー6-ニトロー2、3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキ 25 サゾール(307mg、収率47%)を得た。

融点 186-187.8℃。

4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)ピペリジン、4-(4-トリフルオロメチルベンジル)ピペリジン、4-(4-クロロベンジル)ピペリジン又は4-(クロロベンゾイル)ピペリジンを用い、実施例242と同様にして、実施

例243~実施例246の化合物を製造した。

実施例243

2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペリジン-1-イル] メチル-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

融点 143.5-145℃。

実施例244

5

2-メチルー6-ニトロー2- [4-(4-トリフルオロメチルベンジル) ピペリジンー1-イル] メチルー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾ 10 -ル

融点 125-126℃。

実施例245

15 融点 109-110.5℃

実施例246

20 実施例247

2-メチルー6-ニトロー2- [4-(4-トリフルオロメチルベンゾイル) ピペリジンー1-イル] メチルー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造

実施例6で製造した2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチ25 ル)-4-ニトロイミダゾール(80mg、0.37ミリモル)、4-(4-トリフルオロメチルベンゾイル)ピペリジン(95mg、0.37ミリモル)、酢酸ナトリウム(150mg、1.83ミリモル)及びDMF(2ml)の混合物を80℃にて終夜撹拌した。反応液を水中に注ぎ、酢酸エチルにより2回抽出した。有機相を合わせ、3回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムに

より乾燥した後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル/n-ヘキサン=1/1) により精製し、白色粉末の2-メチルー 6-ニトロー2-[4-(4-トリフルオロメチルベンゾイル) ピペリジン-1-イル] メチルー2、3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (46mg、収率29%) を得た。

融点 172-174℃。

対応する出発原料を用い、実施例247と同様にして、実施例248の化合物・を製造した。

実施例248

10 2-メチル-6-ニトロ-2- [4-(4-トリフルオロメトキシベンゾイル) ピペリジン-1-イル]-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

融点 165-167℃。

実施例 2 4 9

黄色油状物を得た。

25

15 (S) -2-[4-(3,4-ジクロロベンジルオキシ) ピペリジン<math>-1-イル メチル] -2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾールの製造

この黄色油状物をDMF15mlに溶解し、氷冷下に水素化ナトリウム87mg(2.18ミリモル)を加え、室温で終夜撹拌した。反応液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。抽出液を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマ

トグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=10/1) により精製し、塩化メチレンージイソプロピルエーテルより結晶化を行い、白色粉末の (S) -2-[4-(3,4-ジクロロベンジルオキシ) ピペリジン<math>-1-イルメチル]-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール (431mg、収率44%)を得た。

 $MS 441 (M^{+})$

融点 132.0-136.0℃。

実施例250

- (S) -[1-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1]]
- [-b] オキサゾールー [2-4-4] ピペリジンー [4-4] ルオロメトキシフェニル)メタノンの製造

実施例12で製造した(R)-2-クロロ-1-(2-メチルオキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール(1.0g、4.6ミリモル)及び4-(4-トリフルオロメトキシベンゾイル]ピペリジン(1.3g、4.8ミリモル)か

15 ら、実施例249と同様の方法により、微黄色粉末の(S) - [1-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペリジン-4-イル] - (4-トリフルオロメトキシフェニル) メタノン (771mg、収率37%) を得た。

融点 113.0-115.0℃。

- 20 実施例251
 - (S) -1-(2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル) ピペリジンー<math>4-カルボン酸エチルエステルの製造

2-クロロー4-ニトロー1H-イミダゾール (3.7g、25.1ミリモ 25 ル)、(S)-1-(2-メチルー2-オキシラニルメチル)ピペリジンー4ーカルボン酸エチルエステル(4.8g、21.1ミリモル)及び炭酸水素ナトリウム(2.2g、25.1ミリモル)をエタノール25ml中にて終夜加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、残渣に水を加え、塩化メチレンで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濾過した。得られた濾

液を減圧下にて濃縮して、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-n-1 キサン/酢酸エチル= 3/1)により分離精製し、ジエチルエーテルで結晶化することで白色粉末の(S)-1-(2-3) (2-3) (2-3) (3-3) (3-3) (4-3) (2-3) (1-4) (1

融点 101.0-103.0℃。

実施例252

5

- (S) -2-メチル-6-ニトロ-2- [4- (4-トリフルオロメトキシフェニル) -1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イルメチル]-2, 3-
- 10 ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造
 - 4-(4-)リフルオロメトキシフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロ-2H-ピリジン(0. 985g、4. 05ミリモル)及び実施例12で製造した(R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール(0. 839g、3. 86ミリモル)をDMF15m1に加え、
- 15 60℃で8時間撹拌した。酢酸エチルで抽出後、有機相を合わせ、水及び飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=4/1)により精製した。得られた油状物を、DMF20m1に溶解し、4℃まで冷却した。この溶液に水素化ナトリウム(<math>94mg、2.35
- 20 リモル)を加え、室温にて終夜撹拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出後、有機相を合わせ水及び飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(nーヘキサン/酢酸エチル=1/1)により精製後、減圧乾燥することにより、微黄色固体の(S)-2-メチルー6-ニトロ-2-[4-(4-ト
- 25 リフルオロメトキシフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イルメチル]-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (0.192g、収率 23%)を得た。
 - ¹H-NMR (CDCl₃) δppm:
 - 1. 68(3H, s), 2. 46-3.39(8H, m), 3. 95(1H, d)

J=10.2Hz), 4. 49 (1H, br), 5. 98 (1H, s), 7. 1 6 (2H, d, J=8.3Hz), 7. 35 (2H, d, J=8.3Hz), 7. 53 (1H, s).

実施例253

実施例12で製造した(R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール(500mg、2, 30ミリモル)及び

- 10 4-(4-1)フルオロメチルフェノキシ)ピペリジン($730\,\mathrm{mg}$ 、3.0ミリモル)を $\mathrm{DMF}\,10\,\mathrm{m}\,1$ 中、 $70-75\,\mathrm{C}$ にて5時間撹拌した。反応液を室温に戻し、水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。抽出液を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=50/1)
- 15 により精製し、黄色油状物質の(S) -1-(2-クロロー4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-メチル-3-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジン-1-イル] プロパン-2-オール(1.06g、収率99%)を得た。

 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

- 20 1. 14 (3H, s), 1. 80-2. 04 (4H, m), 2, 38 (1H, d, J=14. 0Hz), 2. 48-2. 68 (2H, m), 2. 52 (1H, d, J=14. 0Hz), 2. 77-2. 95 (2H, m), 3. 73 (1H, s), 4. 01 (2H, s), 4. 39-4. 46 (1H, m), 6. 93-6. 97 (2H, m), 7. 49-7. 55 (2H, m), 8. 08 (1H, s).
- 25 実施例 2 5 4

実施例12で製造した(R)-2-クロロ-1-(2-メチルオキシラニルメ

15

チル)-4-ニトロイミダゾール($700 \,\mathrm{mg}$ 、3. $22 \,\mathrm{s}$ リモル)及び4- (4-トリフルオロメチルベンジルオキシ)ピペリジン($1.09 \,\mathrm{g}$ 、4.86 モル)をDMF $10 \,\mathrm{ml}$ 中、 $70-75 \,\mathrm{C}$ にて4時間撹拌した。反応液を室温に戻し、水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。抽出液を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=50/1)により精製し、黄色油状物の(S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-3-[4-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシ)ピペリジン-1-イル〕プロパン-2-オール($1.36 \,\mathrm{g}$ 、収率87%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 12 (3H, s), 1. 61-1. 78 (2H, m), 1. 88-1. 96 (2H, m), 2. 32 (1H, d, J=13. 9Hz), 2. 35-2. 56 (2H, m), 2. 47 (1H, d, J=13. 9Hz), 2. 72-2. 81 (1H, m), 2. 86-2. 95 (1H, m), 3. 44-3. 51 (1H, m), 3. 63 (1H, bs), 3. 97 (2H, s), 4. 59 (2H, s), 7. 43-7. 47 (2H, m), 7. 58-7. 62 (2H, m), 8. 05 (1H, s),

対応する出発原料を用い、実施例254と同様にして、次表に示す実施例25 20 5~260の化合物を製造した。

10

15

20

収率 実施例 R ¹H NMR (CDCl₃) δ (%) 1.13(3H, s), 1.77-1.89(2H, m), 1.91-2.01(2H, m), 2,37(1H, d, J=13.9Hz), 2.45-2.67(2H, m), 2.51(1H, d, 255 J=13.9Hz), 2.75-2.95(2H, m), 3.71(1H, s), 4.00(2H, 4-OCF. 99 s), 4.17-4.34(1H, m), 6.85-6.91(2H, m), 7.11-7.15(2H, m), 8.07(1H, s) 1.13(3H, s), 1.73-1.88(2H, m), 1.91-2.02(2H, m). 2,36(1H, d, J=13.9Hz), 2.44-2.63(2H, m), 2.50(1H, d, 256 J=13.9Hz), 2.76-2.95(2H, m), 3.64(1H, s), 3.99(2H, 4-C1 99 s), 4.26-4.35(1H, m), 6.79-6.86(2H, m), 7.18-7.26(2H, m), 8.06(1H, s). 1.14(3H, s), 1.81-1.92(2H, m), 1.95-2.03(2H, m), 2,36(1H, d, J=13.9Hz), 2.47-2.68(2H, m), 2.51(1H, d, 257 4-CN J=13.9Hz), 2.77-2.94(2H, m), 3.53(1H, s), 4.00(2H, 99 s), 4.40-4.47(1H, m), 6.90-6.96(2H, m), 7.53-7.60(2H, m), 8.06(1H, s). 1.14(3H, s), 1.81-1.91(2H, m), 1.94-2.02(2H, m), 2,37(1H, d, J=13.9Hz), 2.47-2.68(2H, m), 2.51(1H, d, 258 3-CF J=13.9Hz), 2.77-2.97(2H, m), 3.61(1H, s), 3.99(2H, 99 s), 4.38-4.44(1H, m), 7.04-7.12(2H, m), 7.18-7.22(1H, m), 7.35-7.42(1H, m), 8.07(1H, s).

表 14

実施例 ¹H NMR (CDCl₈) δ \mathbf{R} 1.12(3H, s), 1.66-1.76(2H, m), 1.86-1.95(2H, m), 2,32(1H, d, J=13.9Hz), 2,36-2.55(2H, m), 2.46(1H, d, J=13.9Hz), 259 2.72-2.82(1H, m), 2.85-2.96(1H, m), 3.42-3.49(1H, m), OCF. 3.69(1H, s), 4.00(2H, s), 4.52(2H, s), 7.17-7.21(2H, m), 7.35-7.39(2H, m), 8.06(1H, s) 1.10(3H, s), 1.65-1.74(2H, m), 1.85-1.92(2H, m), 2,31(1H, d, J=13.9Hz), 2,38-2.54(2H, m), 2.46(1H, d, J=13.9Hz), 260 Cl 2.71-2.79(1H, m), 2.84-2.95(1H, m), 3.38-3.48(1H, m), 3.72(1H, s), 3.96(2H, s), 4.48(2H, s), 7.23-7.32(2H, m), 8.05(1H, s).

実施例261

(S) -1-(2-クロロー4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-メチル 25 -3-[4-(3-フェニル-2-プロペニルオキシ) ピペリジン-1-イル] プロパン-2-オールの製造

実施例12で製造した (R) -2-クロロ-1- (2-メチル-2-オキシラ ニルメチル) -4-ニトロイミダゾール (0.198g、0.910ミリモル) 及び4- (3-フェニル-2-プロペニルオキシ) ピペリジン (0.198g、

- 5 ¹H-NMR (CDCl₃) δppm: 1. 12 (3H, s), 1. 55-1. 98 (4H, m), 2. 28-2. 94 (6H, m), 3. 41-3. 49 (1H, m), 3. 62 (1H, br), 3. 95 (2H, s), 4. 16 (1H, d, J=6. 0Hz), 4. 17 (1H, d, J=6. 0Hz), 6. 28 (1H, ddd, J=6. 0Hz, 6. 0Hz, 10 15. 9Hz), 6. 60 (1H, d, J=15. 9Hz), 7. 21-7. 4 2 (5H, m), 8. 05 (1H, s).

実施例262

- (S) $-1-(2- クロロー4- ニトロイミダゾールー1- イル) -3- \{4- (3-(4- クロロフェニル) -2- プロペニルオキシ] ピペリジン<math>-1- イ$
- 15 ル} -2-メチルプロパン-2-オールの製造

実施例12で製造した(R) -2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル) -4-ニトロイミダゾール(0.217g、1.00ミリモル)及び4-[3-(4-クロローフェニル)アリルオキシ]ピペリジン(0.250g、0.995ミリモル)を用い、実施例254と同様の方法により、茶色液体20の(S)-1-(2-クロロー4-ニトロイミダゾール-1-イル)-3-{4-[3-(4-クロロフェニル)-2-プロペニルオキシ]ピペリジン-1-イル}-2-メチルプロパン-2-オール(0.263g、収率56%)を得た。

¹H-NMR(CDC1₃)δρρm:

1. 12 (3H, s), 1. 55-2. 01 (4H, m), 2. 28-2. 99
25 (6H, m), 3. 40-3. 51 (1H, m), 3. 60 (1H, br), 3. 96 (2H, s), 4. 13-4. 16 (2H, m), 6. 20-6. 31 (1H, m), 6. 56 (1H, d, J=15. 7Hz), 7. 19-7. 34 (4H, m), 8. 05 (1H, s).

実施例263

実施例12で製造した(R) -2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラ 5 ニルメチル) -4-ニトロイミダゾール(0.103g、0.473ミリモル) 及び4-[3-(4-クロロフェニル) プロポキシ] ピペリジン(0.109g、0.430ミリモル) をDMF2m1に溶解し、60℃にて4時間撹拌した。酢酸エチルで抽出後、有機相を合わせ水及び飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲル

- 10 カラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=2/3)により精製した。得られた油状物を、DMF2m1に溶解し、4 \mathbb{C} まで冷却した。この溶液に水素化ナトリウム(15mg、0. 375ミリモル)を加え、室温にて3時間撹拌した。反応液に水を加え、析出物を濾取した。析出物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=6/1)により精製後、酢酸エチ
- 15 ル/n-ヘキサン=1/3 (6ml) から再結晶し、白色粉末結晶の(S)-2-{4-[3-(4-クロロフェニル) プロポキシ] ピペリジン-1-イルメチル}-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール (36mg、収率19%)を得た。

融点 88.8-91.9℃。

20 実施例 2 6 4

(S) $-1-(2-\rho$ ロロー4ーニトロイミダゾール-1ーイル) $-3-\{4-2-(4-\rho)$ ロロフェニル)エトキシ]ピペリジン-1ーイル-2ーメチループロパン-2ーオールの製造

実施例12で製造した(R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラ25 ニルメチル)-4-ニトロイミダゾール(0.076g、0.350ミリモル)及び4-[2-(4-クロロフェニル)エトキシ]ピペリジン(0.080g、0.334ミリモル)を用い、実施例254と同様の方法により、微黄色油状物の(S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-3-{4-[2-(4-クロロフェニル)エトキシ]ピペリジン-1-イル}-2-メチ

ループロパン-2-オール (0.109g、収率71%) を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

- 1. 10 (3H, s), 1. 51-1. 72 (2H, m), 1. 78-1. 92 (2H, m), 2. 24-2. 50 (4H, m), 2. 55-2. 88 (4H,
- 5 m), 3. 29-3. 39 (1H, m), 3. 58-3. 66 (3H, m), 3. 94 (2H, s), 7. 15 (2H, d, J=8. 5Hz), 7. 24 (2H, d, J=8. 5Hz), 8. 04 (1H, s)。 実施例265

トリフェニルー(4ートリフルオロメチルベンジル)ホスホニウムブロミド(3.00g、5.98ミリモル)をDMSO 50m1に溶解し、氷冷下に水素化ナトリウム(0.239g、5.98ミリモル)を加え、室温で1時間撹拌した。そこへ4ーホルミルオキシピペリジンー1ーカルボン酸ベンジルエステル(1.497g、5.69ミリモル)のDMSO溶液10m1を滴下し、60でにて7時間撹拌した。酢酸エチルで2回抽出後、有機相を合わせ、水及び飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過し、濾液を減圧下にて濃縮した。

残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=4/20 1) により精製した。更にシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=9/1) により精製し、無色油状物の4-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル) ビニルオキシ] ピペリジン-1-カルボン酸ベンジルエステルを得た。

得られた4-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル) ビニルオキシ] ピペ25 リジン-1-カルボン酸ベンジルエステルをエタノール10m1に溶解し、10%Pd/C 90mgを触媒に用いて室温下にて常圧接触還元を行った。反応液をセライト濾過し、濾液を減圧下にて濃縮することにより、茶色液体の4-[2-(トリフルオロメチルフェニル) エトキシ] ピペリジンを得た。

得られた4-[2-(トリフルオロメチルフェニル)エトキシ]ピペリジン及

び実施例 12で製造した(R) -2-クロロー1-(2-メチルー2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール 0. 184g(0. 844ミリモル)を用い、実施例 254 と同様にして、茶色油状物の(S) -1-(2-クロロー4-ニトロイミダゾールー1-イル)-2-メチルー3- $\{4-$ [2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エトキシ]ピペリジン-1-イル}プロパン-2-オール(0. 088g、収率 3%)を得た。

 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1. 10 (3H, s), 1. 49-1. 92 (4H, m), 2. 24-2. 81 (6H, m), 2. 92 (2H, t, J=6. 8Hz), 3. 30-3. 35

10 (1H, m), 3. 65 (2H, t, J=6.8Hz), 3. 94 (2H, s), 7. 34 (2H, d, J=8.2Hz), 7. 54 (2H, d, J=8.2Hz), 8. 04 (1H, s).

実施例266

(S) -1-(2-クロロー4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-メチル 15 -3-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ) ピペリジン-1-イル] プロパン-2-オールの製造

実施例12で製造した(R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール及びN-ピペリジン-4-イル-4-トリフルオロメトキシアニリンを用い、実施例254と同様にして、黄色油状物の

 1 H-NMR (CDCl₃) δ p p m :

1. 13 (3H, s), 1. 41-1. 57 (2H, m), 2. 03-2. 08 25 (2H, m), 2. 34 (1H, d, J=13. 9Hz), 2. 49-2. 59 (3H, m), 2. 65-2. 77 (2H, m), 3. 08-2. 16 (2H, m), 3. 24-3. 41 (1H, m), 3. 97 (2H, s), 6. 47-6. 55 (2H, m), 6. 98-7. 04 (2H, m), 8. 05 (1H, s)。 対応する出発原料を用い、実施例266と同様にして、次表に示す実施例26 7~269の化合物を製造した。

表15

5

実施例	R	収率 (%)	¹H NMR (CDCl₃) δ
267	Cl	99	1.13(3H, s), 1.40-1.53(2H, m), 2.00-2.06(2H, m), 2.35(1H, d, J=13.9Hz), 2.45-2.59(3H,m), 2.71-3.01(2H, m), 3.18(1H, br), 3.48-3.58(2H, m), 3.97(2H, s), 6.47-6.54(2H, m), 7.07-7.14(2H, m), 8.05(1H, s).
268	CF ₃	99	1.14(3H, s), 1.42-1.59(2H, m), 2.03-2.08(2H, m), 2.35(1H, d, J=13.9Hz), 2.49-2.60(2H, m), 2.50(1H, d, J=13.9Hz), 2.74-2.98(2H, m), 3.31-3.39(1H, m), 3.51(1H, s), 3.87(1H, d, J=9.3Hz) 3.97(2H, s), 6.58(2H, d, J=8.7Hz), 7.39(2H, d, J=8.7Hz), 8.05(1H, s).
269	CN	99	1.13(3H, s), 1.40-1.53(2H, m), 2.00-2.06(2H, m), 2.35(1H, d, J=13.9Hz), 2.45-2.59(2H, m), 2.49(1H, d, J=13.9Hz), 2.71-3.01(2H, m), 3.18(1H, br), 3.48-3.58(2H, m), 3.97(2H, s), 6.51-6.57(2H, m), 7.38-7.44(2H, m), 8.05(1H, s).

10

実施例270

(S) -1-(4-ピペリジノピペリジン-1-イル) -3-(2-クロロ-4 15 -ニトロイミダゾール-1-イル) -2-メチループロパン-2-オールの製造 実施例12で製造した(R) -2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル) -4-ニトロイミダゾール(0.500g、2.29ミリモル) と4-ピペリジノピペリジン(0.425g、2.53ミリモル)をDMF5m1 に溶解し、70℃にて5時間撹拌した。酢酸エチルで2回抽出後、有機相を合わ20 せ、水及び飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮し、残渣を塩基性シリカゲルを用いてシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=3/2)により精製し、茶色油状物の(S) -1-(4-ピペリジノピペリジン-1-イル) -3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-メチループロパン-2-オール25 (0.656g、収率74%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 11 (3H, s), 1. 38-1. 89 (10H, m), 2. 18-2. 5 5 (9H, m), 2. 70-2. 81 (1H, m), 2. 89-3. 01 (1H, m), 3. 67 (1H, br), 3. 94 (1H, s), 8. 05 (1H, s).

実施例271

- (S) $-1-(2-\rho pp-4-k-pq-1) 2-k-pq-1$ (S) $-1-(2-\rho pp-4-k-pq-1) 2-k-pq-1$ (S) -1-(4-k-pq-1) 2-k-pq-1 (S) -1-(4-k-p
- 5 実施例12で製造した(R)-2-クロロー1-(2-メチルー2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール及び4-[4-(トリフルオロメトキシ)フェニルスルファニル]ピペリジンを用い、実施例270と同様にして、黄色油状物の(S)-1-(2-クロロー4-ニトロイミダゾールー1-イル)-2-メチルー3-{[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)スルファニ
- 10 ル] ピペリジン-1-イル} プロパン-2-オール (3.4g、収率99%) を 得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 11 (3H, s), 1. 58-1. 73 (2H, m), 1. 91-1. 99 (2H, m), 2. 32 (1H, d, J=13. 9Hz), 2. 41-2. 50

15 (2H, m), 2. 46 (1H, d, J=13. 9Hz), 2. 75-3. 09 (4H, m), 3. 97 (2H, s), 7. 11-7. 17 (2H, m), 7. 36-7. 53 (2H, m), 8. 04 (1H, s).

実施例272

(S) -1-(2-クロロー4ーニトロイミダゾールー1ーイル) -2ーメチル
 20 -3-[4-(4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペリジン-1ーイル] プロパン-2-オールの製造

4-(4-)リフルオロメトキシベンジル)ピペリジン及び実施例 12で製造した (R)-2-クロロー1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾールを用い、実施例 270 と同様にして、黄色油状物の (S)-

- - ¹H-NMR (CDCl₃) δppm:
 - 1. 10 (3H, m), 1. 22-1. 71 (5H, m), 2. 26-2. 55

(6H, m), 2. 66-2. 96 (3H, m), 3. 94 (2H, s), 7. 09-7.18(4H, m), 8.06(1H, s)

対応する出発原料を用い、実施例272と同様にして、次表に示す実施例27 3及び実施例274の化合物を製造した。

5 表16

収率 実施例 R 'H NMR (CDCl₃) δ (%) 1.10(3H, s), 1.14-1.38(2H, m), 1.47-1.64(3H, m), 2.29(1H, d, J=13.9Hz), 2.30·2.40(2H, m), 2.43(1H, d, J=13.9Hz), 2.60(2H, 273 4-CF d, J=6.5Hz), 2.69(1H, d, J=11.7Hz), 2.90(1H, d, J=11.7Hz), 3.74(1H,br) 3.94(2H, s), 7.22-7.26(2H, m), 7.52-7.54(2H, m), 8.05(1H, s) 1.10(3H, s), 1.14-1.63(5H, m), 2.26-2.52(7H, m), 2.68(1H, d, 274 4-C1 J=11.5Hz), 2.90(1H, d, J=11.5Hz), 3.94(2H, s), 7.00-7.08(2H, m), 7.20-7.29(2H, m), 8.05(1H, s).

10

実施例275

(S) -1-(2-クロロー4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-メチル 15 -3-(4-7ェニルー1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジンー1-イル) プ ロパン-2-オールの製造

4-7エニルー1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン塩酸塩(0.495g、 2. 53ミリモル)を塩化メチレン及び水酸化ナトリウム水溶液で抽出し、硫酸 ナトリウムで乾燥した後、濾過した。濾液を減圧濃縮し、濃縮液に、実施例12 20 で製造した(R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル) -4-ニトロイミダゾール (0.5g、2.29ミリモル) 及びDMF 5 m l を 加え、70℃にて5時間撹拌した。反応液を酢酸エチルで2回抽出後、有機相を 合わせ、水及び飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濾過した。

得られた濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー 25 $(n-\Delta+ + \nu)$ 酢酸エチル= 2/1) により精製し、黄色油状物の (S)-1- (2-クロロー4ーニトロイミダゾールー1ーイル) -2ーメチルー3- (4 -フェニル-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イル) プロパン-2 ーオール(0.492g、収率57%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 17 (3H, s), 2. 47 (1H, d, J=13.91Hz), 2. 58 -2.64 (3H, m), 2.78-3.00 (2H, m), 3.27-3.4 0 (2H, m), 3.62 (1H, br), 4.01 (2H, s), 6.02-6. 05 (1H, m), 7. 23-7. 41 (5H, m), 8. 07 (1H, s) 。

実施例276

5

20

- (S) -1-(2-クロロー4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-メチル - 3 - (4 - フェニルピペリジン - 1 - イル)プロパン - 2 - オールの製造
- 4-フェニルピペリジン塩酸塩(0.522g、2.64ミリモル)を塩化メ 10 チレン及び水酸化ナトリウム水溶液で抽出し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濾 過した。濾液を減圧濃縮し、濃縮液に、実施例12で製造した(R) -2-クロ ロー1-(2-メチルー2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール (0.5g、2.29ミリモル)及びDMF5mlを加え、70℃で5時間撹拌。
- した。酢酸エチルで2回抽出後、有機相を合わせ、水及び飽和食塩水で洗浄し、 15 硫酸ナトリウムで乾燥した後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。 残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=2/ 1) により精製し、黄色油状物の(S)-1-(2-クロロー4-ニトロイミダ ゾールー1ーイル) -2-メチル-3-(4-フェニルピペリジン-1-イル)
- プロパン-2-オール (0.703g、収率81%) を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 14 (3H, s), 1. 76-1. 89 (4H, m), 2. 36 (1H, d, J = 13.9 Hz), 2. 48-2.61(4 H, m), 2. 75-2.89(1H, m), 2. 98-3. 09 (1H, m), 3. 75 (1H, br), 3.

- 98 (2H, s), 7. 18-7. 35 (5H, m), 8. 08 (1H, s). 25 実施例277
 - (S) -1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-メチル -3-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル) ピペリジン-1-イル] プロ パンー2ーオールの製造

実施例12で製造した(R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール(0.329g、1.51ミリモル)と4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペリジン(0.400g、1.66ミリモル)をDMF5m1に溶解し、70℃にて3時間撹拌した。酢酸エチルで2回抽出後、有機相を合わせ、水及び飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=2/1)により精製し、茶色油状物の(S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-3-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペリジン-1-

10 イル] プロパン-2-オール(0.361g、収率54%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 13 (3H, s) 1. 71-1. 93 (4H, m), 2. 36 (1H, d, J=14. 0Hz), 2. 48-2. 65 (4H, m), 2. 77-2. 90 (1H, m), 3. 01-3. 14 (1H, m), 3. 64 (1H, br), 3.

15 99 (2H, s), 7. 32 (2H, d, J=8.1Hz), 7. 57 (2H, d, J=8.1Hz), 8. 07 (1H, s).

実施例278

- (S) $-\{1-[3-(2-\rho pp-4-z) 1-(2-\rho pp-$
- 20 tertーブチルエステルの製造

実施例12で製造した(R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール及びピペリジン-4-イルーカルバミン酸 tert te

25 ーヒドロキシー 2ーメチルプロピル] ピペリジンー 4ーイル} カルバミン酸 t e r t - ブチルエステル (収率 9 2 %) を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 11 (3H, s), 1. 32-1. 51 (2H, m), 1. 44 (9H, m), 1. 90-1. 96 (2H, m), 2. 32 (1H, d, I=13.9

Hz), 2. 39-2. 55 (2H, m), 2. 46 (1H, d, J=13. 9 Hz), 2. 67-2. 96 (3H, m), 3. 44 (1H, br), 3. 59 (1H, s), 3. 96 (2H, s), 8. 05 (1H, s)。 実施例279

5 (S) - {1-[3-(2-クロロー4ーニトロイミダゾールー1ーイル)-2 ーヒドロキシー2ーメチループロピル] ピペリジンー4ーイル}-N-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチル]カルバミン酸tertーブチルエステルの製造

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 12 (3H, s), 1. 49 (9H, s), 1. 55-1. 80 (4H,

20 m), 2. 17-2. 57 (4H, m), 2. 70-2. 98 (4H, m), 3. 21-3. 30 (2H, m), 3. 50 (1H, s), 3. 95 (2H, s), 7. 31 (2H, d, J=8. 2Hz), 7. 57 (2H, d, J=8. 2Hz), 8. 05 (1H, s).

実施例280

25 (S) -2-メチル-6-ニトロ-2- [4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジン-1-イルメチル]-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造

実施例253で製造した(S)-1-(2-2)ロロー4-2トロイミダゾール-1-4ル)-2-3チル-3-[4-(4-1)]フルオロメチルフェノキシ)

ピペリジン-1-イル]プロパン-2-オール(1.06g、2.3ミリモル)をDMF15m1に溶解した。この溶液に氷冷下水素化ナトリウム(110mg、2.76ミリモル)を加え、室温にて終夜撹拌した。反応液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=5/1)により精製し、塩化メチレンージイソプロピルエーテルより結晶化を行い、白色粉末の(S)-2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イルメチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(431mg、収244%)を得た。

MS 427 (M+1) + 光学純度 97.8%ee

 $[\alpha]_D^{27} = -2.07^{\circ}$ (濃度: 1.064, CHCl₃) ¹H-NMR (CDCl₃) δ p p m:

15 1. 61 (3H, s), 1. 67-1. 92 (4H, m), 2. 41-2. 51 (1H, m), 2. 57 (1H, d, J=14. 9Hz), 2. 58-2. 67 (1H, m), 2. 88 (1H, d, J=14. 9Hz), 2. 74-2. 98 (2H, m), 3. 91 (1H, d, J=9. 7Hz), 4. 31 (1H, d, J=9. 7Hz), 4. 28-4. 36 (1H, m), 6. 91 (2H, d, J=8. 7Hz), 7. 51 (2H, d, J=8. 7Hz), 7. 54 (1H, s).

実施例281

(S) -2-メチル-6-ニトロ-2- [4-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシ) ピペリジン-1-イルメチル]-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1

25 - b] オキサゾールの製造

4 mg、3.36ミリモル)を加え、室温で終夜撹拌した。反応液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=10/1)により精製し、塩化メチレンージイソプロピルエーテルより結晶化を行い、白色粉末の(S)-2-メチルー6-ニトロ-2-[4-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシ)ピペリジン-1-イルメチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(431 mg、収率44%)を得た。

 $MS 440 (M-1)^{+}$

10 融点 91-92℃

光学純度 99.6%ee

 $[\alpha]_D^{27} = -8.63^{\circ}$ (濃度: 1.066, CHCl₃) 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1. 44-1. 66 (2H, m), 1. 60 (3H, s), 1. 71-1. 85

(2H, m), 2. 28-2. 38 (1H, m), 2. 44-2. 56 (1H, m), 2. 52 (1H, d, J=14. 9Hz), 2. 72-2. 81 (1H, m), 2. 84 (1H, d, J=14. 9Hz), 2. 87-2. 94 (1H, m), 3. 33-3. 41 (1H, m), 3. 88 (1H, d, J=9. 6Hz), 4. 31 (1H, d, J=9. 6Hz), 4. 54 (2H, s), 7. 4

20 1-7. 44 (2H, m), 7. 52 (1H, s), 7. 56-7. 60 (2H,

実施例282

m)。

- (S) -2-[4-(4-h)] フルオロメトキシフェニル) アミノピペリジンー 1-4 メチルー2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2,
- 25 1-b] オキサゾールの製造

実施例266で製造した(S) $-1-(2-\rho pp-4-k-pp-4-k-pp-4-k-pp-4-k-pp-4-k-pp-4-k-pp-4-k-pp-4-k-pp-4-k-pp-4-k-pp-4-k-pp-4-k-pp-4-k-pp-4-k-pp-2-k-pp$

ル) アミノピペリジン-1-イル] メチル-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール(収率73%)を得た。

融点 107.5-109.0℃

 $MS 441 (M^{+})$

5 光学純度 99.8%ee

[α]_D²⁷=19.19°(濃度:1.006, CHCl₃)。 実施例283

- (S) -[1-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペリジン-4-イル] カルバミン酸
- 10 tertーブチルエステルの製造

 $MS 381 (M^{+})$

融点 158.5-160.7℃。

実施例284

20 (S) - [1-(2-メチル-6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル) ピペリジンー4ーイル] ーNー [2-(4-トリフルオロメチルフェニル) エチル] カルバミン酸 tertーブチルエステルの製造

実施例279で製造した(S) - {1-[3-(2-クロロー4-ニトローイ25 ミダゾール-1-イル) - 2-ヒドロキシ-2-メチループロピル] ピペリジンー4-イル} - N-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル) エチル] カルバミン酸tertーブチルエステル(0.37g、0.627ミリモル) を用い、実施例281と同様の方法により、微黄色粉末結晶の(S) - [1-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b] オキサゾール-2-

イルメチル)ピペリジンー4ーイル] -N-[2-(4-)リフルオロメチルフェニル)エチル] カルバミン酸 tert-ブチルエステル(0.211g、収率 63%)を得た。

融点 206.8-208.6℃。

5 実施例285

(S) -2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-$ [4-(トリフルオロメトキシフェニル) スルファニル] ピペリジン-1-イルメチル $\}-2$, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造

実施例 271 で製造した(S) $-1-(2-\rho pp-4-k-pp-4-k$

 $MS 458 (M^{+})$

融点 133.0-137.4℃。

実施例286

(S) -2-メチル-6-ニトロ-2- [4-(4-トリフルオロメトキシベン

20 ジル) ピペリジン-1-イル] メチル-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造

実施例272で製造した(S) -1-(2-0)ロロー4ーニトローイミダゾールー1ーイル) -2-メチルー3ー [4-(4-)トリフルオロメトキシベンジル) ピペリジンー1ーイル] プロパンー2ーオールを用い、実施例281と同様にして、白色粉末の(S) -2-メチルー6ーニトロー2ー [4-(4-)トリフ

ルオロメトキシベンジル)ピペリジン-1-イル] メチル-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール(収率55%)を得た。

融点 111.0-112.5℃

 $MS: 440 (M^{+})$

25

光学純度 99.0%ee

 $[\alpha]_D^{27} = 5.38^{\circ}$ (濃度: 1.004, CHCl₃)。 実施例287

(S) -2-メチル-6-ニトロ-2-(4-フェニル-1, 2, 3, 6-テト 5 ラヒドロピリジン-1-イルメチル) -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1b] オキサゾールの製造

実施例275で製造した(S) -1-(2-クロロー4-ニトローイミダゾールー1ーイル) -2-メチルー3-(4-フェニルー1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジンー1ーイル) プロパン-2-オール(0. 492g、1. 31ミリ10 モル)をDMF8m1に溶解し、4℃まで冷却した。この溶液に水素化ナトリウム(63mg、1. 57ミリモル)を加え、室温にて3時間撹拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出後、有機相を合わせ、水及び飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/アセトン=4/1)により精製後、塩化メチレン及び酢酸エチルから再結晶し、微黄色固体の(S) -2-メチルー6-ニトロー2-(4-フェニルー1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジンー1ーイルメチル) -2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール(0. 059g、収率13%)を得た。

融点 200.1-201℃。

20 実施例288

(S) -2-メチル-6-ニトロ-2-(4-フェニルピペリジン-1-イルメチル) -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造

ルー6ーニトロー2ー(4ーフェニルピペリジンー1ーイルメチル)-2, 3ージヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール(0. 230g、収率36%)を得た。

融点 158.8-163.9℃。

5 対応する出発原料を用い、実施例288と同様にして、実施例289〜実施例294の化合物を製造した。

実施例289

- (S) −1' − (2−メチル−6−ニトロ−2, 3−ジヒドロイミダゾ [2, 1 −b] オキサゾール−2−イルメチル) − [1, 4'] ビピペリジニル
- 10 融点 163.4-164.9℃。

実施例290

- (S) -2-メチル-6-ニトロ-2- [4-(4-トリフルオロメチルフェニル) ピペリジン-1-イルメチル] -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール
- 15 融点 138.7-139.9℃。

実施例291

- (S) -2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(3-フェニル-2-プロペニルオキシ) ピペリジン-1-イルメチル] -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール
- 20 融点 91.3-92.7℃。

実施例292

- 25 融点 140.6-142.8℃。

実施例293

(S) -2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-$ [2- (4-トリフルオロメチルフェニル) エトキシ] ピペリジン-1-イルメチル $\}-2$, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

10

融点 84.6-86.8℃。

実施例 2 9 4

融点 92.5-94℃。

実施例295

(S) - [1 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル)ピペリジン <math>- 4 -イル] - N -メチル - (4 -トリフルオロメトキシフェニル)アミンの製造

実施例282で製造した(S) -2-[4-(4-h)] アミノピペリジン-1-h メチル-2-x チル-6-h -2 、3 -3 と -3

- 15 m1、4.52ミリモル)、シアノトリヒドロホウ酸ナトリウム(170mg、2.71ミリモル)及び酢酸(0.17ml、2.71ミリモル)を加え、30分室温で撹拌した。反応液を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注ぎ、塩化メチレンで抽出した。有機相を硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレ
- 20 ン/メタノール=100/1)により精製し、塩化メチレンージイソプロピルエーテルから再結晶して、淡黄色針状結晶の(S)ー[1-(2-メチルー6ーニトロー2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールー2ーイルメチル)ピペリジンー4ーイル]-N-メチルー(4ートリフルオロメトキシフェニル)アミン(309mg、収率78%)を得た。
- 25 光学純度 99.9% e e

 $[\alpha]_{d}^{17}=7.77$ (濃度: 1.042、CHC13)

 $MS 455 (M^{+})$

融点 133.2-134.4℃。

実施例296

(S) -N-[1-(2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル) ピペリジンー<math>4-イル] -N-(4-トリフルオロメトキシフェニル) アセトアミドの製造

実施例282で製造した(S) -2- [4-(4-トリフルオロメトキシフェ 5 ニル)アミノピペリジン-1-イル]メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3 ージヒドロイミダゾ [2,1-b]オキサゾール(153mg、0.35ミリモル)を塩化メチレン5mlに溶解し、トリエチルアミン76μl及びアセチルクロリド30μlを加え、1.5時間室温で撹拌した。反応液を水に注ぎ、塩化メチレンで抽出した。有機相を硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾がを減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=100/1)により精製し、塩化メチレンージイソプロピルエーテルで結晶化して、白色粉末の(S)-N-[1-(2-メチルー6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペリジン-4-イル]-N-(4-トリフルオロメトキシフェニル)アセ15トアミド(82mg、収率49%)を得た。

 $MS 484 (M+1)^{+}$

融点 137.0-138.7℃。

実施例297

(S) -2- {4-N-[(4-トリフルオロメチルフェニル) アセチル] アミ 20 ノピペリジン-1-イル} メチル-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロ イミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造

実施例283で製造した(S)-[1-(2-メチルー6-ニトロー2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールー2ーイルメチル)ピペリジンー4ーイル]カルバミン酸tertーブチルエステル(0.1g、0.262ミリ25 モル)をエタノール4mlに溶解し、6規定の塩酸3mlを加え、室温で5時間撹拌した。反応液を減圧濃縮後、濃縮液に塩化メチレン4ml及びトリエチルアミン4mlを加え、室温で5分撹拌後、濃縮した。トルエン10mlを加え、濃縮することにより、水を共沸した。濃縮液に4ートリフルオロメチルフェニル酢酸(0.064g、0.315ミリモル)、塩化メチレン4ml、トリエチルア

ミン (0.06 m1、0.393ミリモル)及び1ーエチルー3ー(3ージメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩(WSCD)(0.065g、0.341ミリモル)を加えて室温で終夜攪拌した。反応液に水を加え、塩化メチレンで2回抽出後、有機相を合わせ、水及び飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(nーヘキサン/アセトン=3/2により精製した。酢酸エチル3 m1から再結晶し、白色粉末結晶の(S)-2ー{4-N-[(4ートリフルオロメチルフェニル)アセチル]アミノピペリジン-1ーイル}メチルー2ーメチルー6ーニトロー2、3ージヒドロイミダゾ[2、1ーb]オキサゾール(32 mg、収率26%)を得た。

融点 152.7-154.3℃。

実施例298

10

15

(S) - [1-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペリジン-4-イル] カルバミン酸4-トリフルオロメチルベンジルエステルの製造

実施例283で製造した(S)-[1-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル) ピペリジンー 4-イル] カルバミン酸 t e r t - ブチルエステル (0.300g、0.787 ミリモル)を塩化メチレン4mlに溶解し、トリフルオロ酢酸2mlを加え、2 時間室温で撹拌した。反応液を減圧下濃縮し、塩化メチレン及びトリエチルアミ 20 ンを4m1ずつ加えた。この混合物を室温で5分撹拌した後、減圧下濃縮した。 残渣をDMF6mlに溶解した。この溶液に、4-(トリフルオロメチル)ベン ジルアルコール (0.166g、0.944ミリモル) をDMF4mlに溶解し、 1, 1'-カルボニルジイミダゾール(0.153g、0.944ミリモル)を 加えて4時間室温で撹拌した混合物を加えた。この混合物を室温で終夜撹拌後、 25 65℃にて8時間撹拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルで2回抽出後、有機 相を合わせ、水及び飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濾過し た。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラ フィー (n-ヘキサン/アセトン=2/1) により精製した。酢酸エチルより再

結晶し、濾取後減圧乾燥することにより、微黄色粉末結晶の(S) - [1-(2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2-イルメチル) ピペリジンー4-イル] カルバミン酸4-トリフルオロメチルベンジルエステル(0.107g、収率28%)を得た。

5 融点 141.2-144℃。

対応する出発原料を用い、実施例298と同様にして、実施例299及び実施例300の化合物を製造した。

実施例299

(S) - [1-(2-メチル-6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1
 10 - b] オキサゾールー2ーイルメチル) ピペリジンー4ーイル] カルバミン酸1 - (4-トリフルオロメチルフェニル) ピペリジンー4ーイルエステル

融点 134.4-136.9℃。

実施例300

(S) - [1-(2-メチル-6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾールー2ーイルメチル) ピペリジンー4ーイル] カルバミン酸4

ートリフルオロメトキシベンジルエステル

融点 156.2-158.5℃。

実施例301

(S) - [1-(2-メチル-6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1
 20 - b] オキサゾールー2ーイルメチル) ピペリジンー4ーイル] - (4ートリフルオロメチルベンジル) アミンの製造

実施例283で製造した(S) - [1-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペリジンー4-イル] カルバミン酸tertーブチルエステル(0.300g、0.78725 ミリモル)を塩化メチレン4mlに溶解し、トリフルオロ酢酸2mlを加え、室温で1時間撹拌した。反応液を減圧下濃縮し、塩化メチレン及びトリエチルアミンを4mlずつを加えた。この混合物を室温で20分撹拌した後、減圧下濃縮した。残渣をメタノール4mlに溶解し、そこへ4-トリフルオロメチルベンズアルデヒド(0.164g、0.945ミリモル)、シアノトリヒドロホウ酸ナト

リウム (0.099g、1.57ミリモル)及び酢酸 (0.09ml、1.57ミリモル)を加え、室温で4時間撹拌した。反応液を減圧濃縮後、残渣に水を加え、塩化メチレンで抽出した。有機相を合わせ、飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=20/1)により精製した。イソプロピルアルコールから再結晶し、濾取後減圧乾燥することにより、微黄色粉末結晶の(S)ー[1ー(2ーメチルー6ーニトロー2,3ージヒドロイミダゾ[2,1ーb]オキサゾールー2ーイルメチル)ピペリジンー4ーイル]ー(4ートリフルオロメチルベンジル)アミン(0.078g、収率22%)を得た。

融点 148.6-152.9℃。

実施例302

10

15

20

(S) -1-[1-(2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル) ピペリジンー<math>4-イル] -3-(4-トリフルオロメチルフェニル) ウレアの製造

実施例283で製造した(S) - [1-(2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル) ピペリジンー4ーイル] カルバミン酸 tertーブチルエステル(0.300g、0.787ミリモル) を塩化メチレン4mlに溶解し、トリフルオロ酢酸2mlを加え、2時間室温で撹拌した。減圧下濃縮し、塩化メチレン及びトリエチルアミンを4mlずつ加え、室温で5分撹拌した後、減圧下濃縮した。これを「残渣1」とする。

一方、4ートリフルオロメチルアニリン(0.139g、0.865ミリモル)をTHF4mlに溶解し、ピリジン(0.07ml、0.865ミリモル)25 を加え、氷冷下、クロロギ酸フェニル(0.108ml、0.865ミリモル)を加え、室温で1時間反応した。反応液を酢酸エチルで希釈後、水、10%塩酸及び飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。

得られた残渣をジメチルスルホキシド6m1に溶解した。これを先ほどの「残

渣1」に加え、室温で終夜撹拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルで2回抽出後、有機相を合わせ、水、飽和重曹水及び飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(nーヘキサン/アセトン=2/1)により精製した。イソプロピルアルコール/nーヘキサン(1/1)6m1から再結晶し、濾取後減圧乾燥することにより、微黄色粉末結晶の(S)−1−[1−(2−メチル−6−ニトロ−2,3−ジヒドロイミダゾ[2,1−b]オキサゾール−2−イルメチル)ピペリジン−4−イル]−3−(4−トリフルオロメチルフェニル)ウレア(0.064g、収率17%)を得た。

10 融点 136.8-139.9℃。

実施例303

- (S) -2-[4-N-(4-h)] フルオロメチルベンゾイル) アミノピペリジンー1-イル] メチルー2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造
- 15 実施例283で製造した(S)-[1-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペリジンー4-イル] カルバミン酸tertーブチルエステル(360mg、0.92ミリモル)を塩化メチレン5mlに溶解し、トリフルオロ酢酸5mlを加え、5時間室温で撹拌した。反応液を減圧下濃縮し、塩化メチレン10ml及びトリエチルフトン2mlを加え、続いて4-トリフルオロメチルジングイストロンドクス
- 20 アミン2m1を加え、続いて4ートリフルオロメチルベンゾイルクロリド(0.3m1、1.85ミリモル)を加え、室温で1時間撹拌した。反応液を水に注ぎ、塩化メチレンで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=20/1)により分離精製し
- 25 た。酢酸エチルージイソプロピルエーテルより結晶化を行い、濾取後減圧乾燥することにより、白色粉末の(S)-2-[4-N-(4-N)] アミノピペリジン-1-1 メチル-2- メチル-6- ニトロ-2 、3 ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール(232 mg、収率55%)を得た。

MS 454 (M+H) + 融点 170.5-171.7℃。

実施例304

(S) - [1-(2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1
 5 - b] オキサゾールー2ーイルメチル) ピペリジンー4ーイル] - 2-(4-トリフルオロメチルフェニル) エチルアミンの製造

実施例284で製造した(S)-[1-(2-メチル-6-ニトロー2, 3-

ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル) ピペリジンー

4-イル] -N-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル) エチル] カルバミ ン酸 t e r t - ブチルエステル (0.196g、0.354ミリモル) を塩化メチレン2mlに溶解し、トリフルオロ酢酸1mlを加え、室温で4時間撹拌した。 反応液に飽和重曹水を加え、塩化メチレンで2回抽出した。有機相を合わせ、硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=10/1)で

- 15 精製し、イソプロピルエーテルを加え固化させ、濾取後減圧乾燥することにより、 微黄色粉末結晶の (S) [1-(2-メチル-6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル)ピペリジンー4ーイル] <math>-2-(4-トリフルオロメチルフェニル) エチルアミン (0.020g、収率12%)を得た。
- 20 融点 80.7-84.2℃。

実施例305

- (S) -2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-$ [4- (トリフルオロメトキシ) ベンゼンスルフィニル] ピペリジン-1-イルメチル $\}$ -2 , 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b] オキサゾールの製造
- 実施例285で製造した(S) -2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(トリフルオロメトキシフェニル) スルファニル] ピペリジン-1-イルメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b] オキサゾール(300mg、0.65ミリモル)を塩化メチレン5mlに溶解した。この溶液にm-クロロ過安息香酸(169mg、0.69ミリモル)を加え、室温で30分撹拌した。反応液

を塩化メチレンで希釈し、チオ硫酸ナトリウム水溶液、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクログラフィー(塩化メチレン/メタノール=50/1)により精製し、酢酸エチルーイソプロピルエーテルから結晶化させた。結晶を濾取し、乾燥することにより、白色粉末の(S)-2-メチルー6-ニトロ-2-{4-[4-(トリフルオロメトキシ)ベンゼンスルフィニル]ピペリジン-1-イルメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(219mg、収率71%)を得た。

 $MS 475 (M+H)^{+}$

10 融点 107-109℃。

実施例306

2-(4-tert-ブトキシカルボニルピペラジン-1-イル)メチルー2 -メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダブ[2, 1-b] オキサゾールの製造

- 2ークロロー4ーニトロー1 Hーイミダゾール (3. 19g、21.6ミリモル)と4ー(2ーメチルー2ーオキシラニルメチル)ピペラジンー1ーカルボン酸tertーブチルエステル(5.53g、21.6ミリモル)及び酢酸ナトリウム(1.95g、23.8ミリモル)を1ープロパノール50m1に溶解させ、48時間加熱還流した。反応液を塩化メチレンで希釈後、水及び飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=100/1)により精製後、塩化メチレンージイソプロピルエーテルを加え結晶化した。濾取後減圧乾燥することにより白色粉末結晶の2ー(4ーtertーブトキシカルボニルピペラジンー1ーイル)メチルー2ーメチルー6つニトロー2、3ージヒドロイミダゾ[2、1ーb]オキサゾール(1.85g、収率23%)を得た。
 - ¹H-NMR (CDCl₃) δ p p m: 1. 43 (9H, s), 1. 62 (3H, s), 2. 45-2. 68 (5H, m), 2. 87 (1H, d, J=14. 9Hz), 3. 30 (4H, br), 3.

93 (1H, d, J=9.7Hz), 4.30 (1H, d, J=9.7Hz), 7.54 (1H, s).

対応する出発原料を用い、実施例306と同様にして、実施例307の化合物を製造した。

5 実施例307

2-[4-(4-) アノフェニル) ピペラジン-1-イル] メチル-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール 収率 1.8%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

10 1.67 (3H, s), 2.60-2.80 (3H, m), 2.80-3.00 (3H, m), 3.22 (4H, br), 3.97 (1H, d, J=9.8 Hz), 4.35-4.50 (1H, m), 6.78-6.85 (2H, m), 7.46-7.51 (2H, m), 7.55 (1H, s)。 実施例308

15 2-[4-(4-)リフルオロメチルフェニル)ピペラジン-1-イル] メチル-2-メチル-6-ニトロ-2、3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造

2ークロロー4ーニトロー1Hーイミダゾール(1.59g、10.8ミリモル)及び1ー(2ーメチルー2ーオキラニルメチル)-4ー(4ートリフルオロ メチルフェニル)ピペラジン(3.23g、10.8ミリモル)の1ープロパノール(20ml)溶液に炭酸水素ナトリウム(1.95g、23.8ミリモル)を加え終夜加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、塩化メチレンで抽出し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=100/1)で分離精 25 製し、塩化メチレンーイソプロピルエーテルにて結晶化させて、淡黄色粉末の2ー[4ー(4ートリフルオロメチルフェニル)ピペラジンー1ーイル]メチルー2ーメチルー6ーニトロー2、3ージヒドロイミダゾ[2,1ーb]オキサゾー

 $MS 411 (M^{+})$

ル(1.34g、収率29%)を得た。

融点159-160℃。

また上記シリカゲルカラムクロマトグラフィーによる分離精製により、中間体である 2- クロロー1- $\{3-$ [4- (4- トリフルオロメチルフェニル) ピペラジンー1- イル]-2- ヒドロキシー2- メチル $\}$ プロピルー4- ニトロイミダゾールを黄色油状物として得た(697mg、収率15%)。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 17 (3H, s), 2. 32-2. 91 (6H, s), 3. 26-3. 31 (4H, m), 4. 03 (2H, s), 6. 71 (1H, s), 6. 89-6. 93 (2H, m), 7. 45-7. 51 (2H, m), 8. 06 (1H, s).

10 対応する出発原料を用い、実施例308と同様にして、実施例309〜実施例311の化合物を製造した。

実施例309

15 収率32%、融点 223-227.8℃。

実施例310

20 実施例311

2-[4-(4-h)]フルオロメトキシフェニル)ピペラジンー1-4ル] メチルー2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

収率18%

25 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1. 61 (3H, s), 2. 61 (1H, d, J=14.8Hz), 2. 65-2. 73 (2H, m), 2. 82-2. 95 (2H, m), 2. 93 (1H, d, J=14.8Hz), 2. 99-3. 09 (4H, m), 3. 94 (1H, d, J=9.7Hz), 4. 34 (1H, d, J=9.7Hz), 6. 78-6. 8

6 (2H, m), 7. 06-7. 11 (2H, m), 7. 53 (1H, s)。 実施例312

1-[3-(4-tert-ブトキシカルボニルピペラジン-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチル] プロピル-2-クロロ-4-ニトロイミダゾールの製 5 造

 $2-\rho$ ロロー4ーニトロー1 Hーイミダゾール(863 m g、5.85 ミリモル)及び4ー(2 ーメチルー2 ーオキシラニルメチル)ピペラジンー1 ーカルボン酸 t e r t ーブチルエステル(1.5 g、5.85 ミリモル))を1 ープロパノール(10 m)に溶解し、6 時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下、

- 10 濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=100/1)により精製し、白色粉末結晶の1-[3-(4-tert-ブトキシカルボニルピペラジン-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチル]プロピル-2-クロロー4-ニトロイミダゾール(705mg、収率29.8%)を得た。
- 15 ¹H-NMR (CDCl₃) δppm:
 1. 15 (3H, s), 1. 45 (9H, s), 2. 35 (1H, d, J=13. 9Hz), 2. 45-2. 65 (5H, m), 3. 25 (1H, s), 3. 42 (4H, t, J=4. 3Hz), 4. 00 (2H, s), 8. 05 (1H, s)。
 2-クロロー4ーニトロー1Hーイミダゾール及び4-(2ーオキシラニルメ
- 25 実施例313

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

WO 2004/033463 PCT/JP2003/013070

1. 46 (9H, s), 2. 16-2. 50 (4H, m), 2. 55-2. 70 (2H, m), 3. 40-3. 51 (4H, m), 3. 64 (1H, s), 3. 91-4. 09 (2H, m), 4. 17 (1H, dd, J=2. 0Hz, 13. 5Hz), 8. 00 (1H, s).

5 実施例314

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

- 10 1. 23 (3H, s), 1. 40-1. 74 (11H, m), 2. 23-2. 5 8 (5H, m), 2. 81-2. 95 (1H, m), 3. 26-3. 51 (4H, m), 3. 91 (1H, d, J=14. 0Hz), 3. 99 (1H, d, J=14. 0Hz), 6. 94 (1H, s), 8. 07 (1H, s)。 実施例315
- 15 $4-[3-(2-\rho pp-4-z)-4-z]$ $4-[3-(2-\rho pp-4-z)-4-z]$ $4-[3-(2-\rho pp-4-z)-4-z]$ 2-z 2-

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 14 (3H, s), 2. 35-2. 76 (6H, m), 3. 43-3. 61

20 (4H, m), 4. 01 (2H, s), 5. 13 (2H, s), 7. 28-7. 43 (5H, m), 8. 04 (1H, s).

実施例316

4- [3-(2-クロロー4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-ヒドロキシー2-メチルプロピル] ピペラジン-1-カルボン酸イソブチルエステルの製

25 造

実施例312で製造した1-[3-(4-tert-ブトキシカルボニルピペラジン-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチル]プロピル-2-クロロ-4-ニトロイミダゾール(<math>150mg、0.37ミリモル)及びトリフルオロ酢酸(5ml)の混合物を5時間室温で撹拌した。反応液を減圧濃縮した。残渣を塩

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

0. 93 (6H, d, J=6. 7Hz), 1. 14 (3H, s), 1. 82-2.

15 4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキ サゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸ベンジルエステルの製 造

実施例315で製造した4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾールー 1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル] ピペラジン-1-カルボン

- 20 酸ベンジルエステル(55.22g、126.11ミリモル)及び1,4ージオキサン(550ml)の混合物に水素化ナトリウム(6.05g、151.25ミリモル)を加え、14時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に水を加え、塩化メチレンにより2回抽出し、飽和食塩水により洗浄し、硫酸マグネシムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧濃縮し、残渣を
- 25 シリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル)により精製し、白色粉末結晶の4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸ベンジルエステル(26.54g、収率52%)を得た。

融点130.5-132.1℃

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 61 (3H, s), 2. 38-2. 69 (5H, m), 2. 86 (1H, d,

J=14.8Hz), 3. 10-3.50 (4H, m), 3. 92 (1H, d, J=9.9Hz), 4. 33 (1H, d, J=9.9Hz), 5. 11 (2H,

5 s), 7. 23-7. 38 (5H, m), 7. 53 (1H, s).

対応する出発原料を用い、実施例317と同様にして、実施例318~実施例320の化合物を製造した。

実施例318

4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキ

10 サゾールー2ーイルメチル) ピペラジンー1ーカルボン酸イソブチルエステル 微黄色粉末結晶、収率39%、融点176.5-177.3℃。

実施例319

15 白色粉末結晶、収率45%、融点185-188℃ (分解)

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 45 (9H, s), 2. 48-2. 58 (4H, m), 2. 85 (2H, d, J=5. 1Hz), 3. 31-3. 45 (4H, m), 4. 20 (1H, dd,

J=6.9Hz, 10. 3Hz), 4. 34(1H, dd, J=8.4Hz, 1

20 0.3Hz), 5.35-5.48(1H, m), 7.55(1H, s)。 実施例320

4-[2-(2-xチルー6-ニトロー2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b] オキサゾールー2ーイル) エチル] ピペラジンー<math>1-カルボン酸tert-ブチルエステル

25 微黄色粉末、収率70%、融点 190-191℃(分解)。

実施例321

4- [3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イル)プロピル]ピペラジ-1-カルボン酸tertーブチルエステルの製造

実施例39で製造したメタンスルホン酸3-(2-メチルー6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールー2-イル)プロピルエステル(2g、6.6ミリモル)、ピペラジン-1-カルボン酸tertーブチルエステル(1.4g、7.5ミリモル)、トリエチルアミン(1.3g、12.85ミリモル)、ヨウ化カリウム(1.8g、10.8ミリモル)及びDMF(15m1)の混合物を60℃にて終夜撹拌した。反応液を室温に戻し、水を加え、酢酸エチルにより3回抽出した。有機相を合わせ、2回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=1020/1)により精製し、白色粉末の4-[3-(2-メチルー6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールー2-イル)プロピル]ピペラジー1ーカルボン酸tertーブチルエステル(1.9g、収率73%)を得た。

融点 166-167℃。

15 実施例322

得た。

2-メチルー6-ニトロー2-(ピペラジンー1-イルメチル)-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール・二塩酸塩の製造

実施例306で製造した2-(4-tert-ブトキシカルボニルピペラジン-1-イル)メチルー2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2,

- 20 1-b]オキサゾール(1,19g、3.24ミリモル)をトリフルオロ酢酸(30ml)に溶解し、3時間室温で撹拌した。反応液を減圧濃縮し、残渣をメタノール(30ml)に溶解し、氷冷撹拌した。塩化水素の酢酸エチル溶液を少しずつ加え、同温度で30分撹拌した。析出した結晶を濾取して黄色粉末の2-メチルー6-ニトロー2-(ピペラジン-1-イルメチル)-2,3-ジェドロ25 イミダゾ[2,1-b]オキサゾール・二塩酸塩(1.06g、収率96%)を
 - 1 H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm: 1. 68 (3H, s), 3. 00-3. 59 (6H, m), 4. 14 (1H, d, J=11. 1Hz), 4. 36 (1H, d, J=11. 1Hz), 4. 50-6.

- 12 (4H, br), 8. 17 (1H, s), 9. 62 (2H, br)。 実施例 3 2 3
- 2-[4-(4-ビフェニリルメチル) ピペラジン<math>-1-イルメチル] -6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造
- 5 実施例319で製造した4-(6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸 tert ーブチルエステル(400mg、1.13ミリモル)及びトリフルオロ酢酸(10ml)の混合物を4時間室温で撹拌した。反応液を濃縮し、残渣を塩化メチレン(10ml)に溶解し、トリエチルアミン(2ml、14.35ミリモル)を
- 加え、中和した。得られる液を減圧下にて濃縮し、残渣をメタノール(10 ml)に溶解し、次いでこれに4-フェニルベンズアルデヒド(515mg、2.83ミリモル)、シアノトリヒドロホウ酸ナトリウム(214mg、3.41ミリモル)、酢酸(0.21m、3.67ミリモル)の順に加え、終夜室温で撹拌した。反応液を濃縮し、残渣に水を加え、塩化メチレンで2回抽出した。有機相
- 15 を合わせ、飽和重曹水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=20/1)により精製し、白色粉末の2-[4-(4-ビフェニリルメチル)ピペラジン-1-イルメチル]-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(188mg、収20 率40%)を得た。

融点 183-185℃(分解)。

対応する出発原料を用い、実施例323と同様にして、実施例324~実施例329の化合物を製造した。

実施例324

白色粉末、収率36%、融点 148−149℃。

実施例325

2-メチル-6-ニトロ-2- $\{3-$ [4- (4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン-1-イル] プロピル $\}-2$, 3-ジヒドロイミダブ [2, 1- b] オキサゾール

白色粉末、収率57%、融点 154-156℃。

5 実施例326

白色粉末、収率53%、融点 181-182℃。

10 実施例327

白色粉末、収率65%、融点 176-178℃。

15 実施例328

4-(N, N-i)メチルアミノ)-4'-[4-(2-i)+n-6-i]3-iビドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-iイルメチル)ピペラジ ン-1-iイルメチル] ビフェニル

白色粉末、収率 68%

 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1. 58 (3H, s), 2. 36 (4H, br), 2. 50-2. 60 (2H,

m), 2.54 (1H, d, J=14.8Hz), 2.67-2.76 (2H,

m), 2.84 (1H, d, J=14.8Hz), 2.99 (6H, s), 3.

41 (1H, d, J=12.9Hz), 3.48 (1H, d, J=12.9

25 Hz), 3. 87 (1H, d, J=9. 7Hz), 4. 30 (1H, d, J=9. 7Hz), 6. 76-6. 82 (2H, m), 7. 25-7. 29 (2H, m), 7. 46-7. 51 (4H, m), 7. 53 (1H, s).

実施例329

2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(2-フェニル-1H-イミダゾール-4

白色粉末、収率93%

 $^{1}H-NMR$ (DMSO-d₆) δ ppm:

- 5 1. 52 (3H, s), 2. 10-2. 64 (6H, m), 2. 67 (1H, d, J=15. 4Hz), 2. 74 (1H, d, J=15. 4Hz), 3. 10-3. 70 (4H, br), 4. 04 (1H, d, J=10. 7Hz), 4. 21 (1H, d, J=10. 7Hz), 6. 97 (1H, br), 7. 27-7. 34 (1H, m), 7. 38-7. 45 (2H, m), 7. 88-7. 93 (2H, d)
- 10 m), 8. 12 (1H, s).

実施例330

- 2-(3, 4-ジクロロフェニル) -1-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル] エタノンの製造
- 15 3,4-(ジクロロフェニル) 酢酸(418mg、2.04ミリモル)及び塩化チオニル(3ml)の混合物を6時間加熱還流した。反応液を減圧下にて濃縮し、対応する酸クロリドを得た。

一方、実施例306で製造した2-(4-tert-ブトキシカルボニルピペラジン-1-イル)メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダン [2,1-b]オキサゾール(300mg、0.816ミリモル)及びトリフルオロ酢酸(6m1)の混合物を室温下にて6時間撹拌した。反応液を減圧下にて濃縮した。残渣を塩化メチレン10mlに溶解し、トリエチルアミン(2ml、14.35ミリモル)を加えた。この溶液に、氷冷下にて上記で得られた酸クロリドを塩化メチレン5mlに溶解した溶液を徐々に加え、室温下にて30分撹拌した。反応液を飽和重曹水、水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=100/1)により精製し、白色粉末結晶の2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-[4-(2-メチルー

6-ニトロー2、3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールー2-イル

メチル)ピペラジン-1-イル] エタノン(255mg、収率69%)を得た。 融点 189-191℃。

対応する出発原料を用い、実施例330と同様にして、実施例331及び実施例332の化合物を得た。

5 実施例331

融点 168-171.4℃。

10 実施例332

2-(3, 4-ij) ロロフェノキシ) -1-[4-(2-ij)] -1-[4-(2-ij)]

融点 209-211℃。

15 実施例 3 3 3

2-[4-(2-メチル-6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル)ピペラジンー<math>1-イル] -N-(4-トリフルオロメチルフェニル)アセトアミドの製造

実施例306で製造した2-(4-tert-ブトキシカルボニルピペラジン20 -1-イル)メチルー2-メチルー6-ニトロー2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(500mg、1.36ミリモル)及びトリフルオロ酢酸(15ml)の混合物を室温下にて終夜撹拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣を塩化メチレン(10ml)に溶解し、トリエチルアミン(2ml、14.35ミリモル)を加え、中和した。この液を減圧下にて濃縮し、残渣をDMF(10ml)に溶解し、これに2-ブロモーN-(4-トリフルオロメチルフェニル)アセトアミド(423mg、1.5ミリモル)、炭酸カリウム(207mg、1.5ミリモル)及びヨウ化ナトリウム(204mg、1.36ミリモル)を加え、5時間室温で撹拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルで2回抽出した。有機相を合わせ、3回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウム

%)を得た。

により乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=100/1)により精製し、白色粉末の2-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)アセトアミド(<math>389mg、収率61

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 62 (3H, s), 2. 53-2. 84 (9H, m), 2. 88 (1H, d, J=14. 8Hz), 3. 06 (1H, d, J=16. 7Hz), 3. 14 (1

H, d, J=16.7Hz), 3.93 (1H, d, J=9.7Hz), 4.3
 O(1H, d, J=9.7Hz), 7.55 (1H, s), 7.55-7.59
 (2H, m), 7.65-7.71 (2H, m), 9.20 (1H, s)。
 対応する出発原料を用い、実施例333と同様にして、実施例334~実施例336の化合物を製造した。

15 実施例334

[4-(2-メチル-6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オ キサゾールー2ーイルメチル) ピペラジンー<math>1-イル] 酢酸エチルエステル 1H-NMR(CDCl3) δ ppm:

1. 25 (3H, t, J=7. 1Hz), 1. 60 (3H, s), 2. 45-2.

- 20 64 (6H, m), 2.55 (1H, d, J=14.8Hz), 2.72-2.81 (2H, m), 2.87 (1H, d, J=14.8Hz), 3.14 (2H, s), 3.90 (1H, d, J=9.7Hz), 4.16 (2H, q, J=7.1Hz), 4.31 (1H, d, J=9.7Hz), 7.57 (1H, s)。 実施例335

融点 123-126℃。

実施例336

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

- 5 1. 60 (3H, s), 2. 47 (4H, br), 2. 53 (1H, d, J=1 4. 9Hz), 2. 57-2. 65 (2H, m), 2. 74-2. 84 (2H, m), 2. 87 (1H, d, J=14. 9Hz), 3. 64 (1H, d, J=1 6. 7Hz), 3. 75 (1H, d, J=16. 7Hz), 3. 90 (1H, d, J=9. 7Hz), 4. 30 (1H, d, J=9. 7Hz), 7. 42 (2H,
- 10 d, J=8.6Hz), 7.54 (1H, s), 7.92 (2H, d, J=8.6Hz).

実施例337

4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸ベンジルエステル塩酸

15 塩の製造

実施例 306で製造した 2-(4-tert-ブトキシカルボニルピペラジン-1-イル) メチルー 2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール(130mg、0.35ミリモル)、トリフルオロ酢酸(3m1)及び塩化メチレン(5m1)の混合物を室温下にて1時間撹拌した。

- 20 反応液を減圧下にて濃縮し、残渣を塩化メチレン(5m1)に溶解し、トリエチルアミン(107.5mg、1.06ミリモル)を加えた。この液に氷冷下にてクロロギ酸ベンジル(120mg、0.71ミリモル)を加え、室温下にて1時間撹拌した。反応液を水、飽和重曹水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲル
- 25 カラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=20/1)により精製し、黄色オイルを得た。このオイルを酢酸エチル(5 m l)に溶解した。そこへ飽和塩酸酢酸エチル溶液を加え、析出晶を濾取することにより、白色粉末結晶の4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸ベンジルエステル塩酸

塩(46.8mg、収率30%)を得た。

融点 130.5-132.1℃。

対応する出発原料を用い、実施例337と同様にして、実施例338~340 の化合物を製造した。

5 実施例338

4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸フェニルエステル融点 81-85 \mathbb{C} 。

実施例339

実施例340

4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキ 15 サゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸n-オクチルエステル 融点 138-139.4℃。

実施例341

4-(6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2 ーイルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸4-トリフルオロメチルベンジルエ

20 ステルの製造

25

一方、4-トリフルオロメチルベンジルアルコール(297 mg、1.69 ミリモル)をDMF(<math>1 m1)に溶解し、1,1'-カルボニルジイミダゾール(274 mg、1.69 ミリモル)を加え、室温下にて<math>1時間撹拌し、活性エス

テルを調製した。

この活性エステルの溶液を上記の中和液に加え、室温下にて3時間撹拌した。 反応液に水を加え、酢酸エチルにより2回抽出した。有機相を合わせ、2回水洗後、飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=20/1)により精製し、微黄色粉末結晶の4-(6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸4-トリフルオロメチルベンジルエステル(322mg、収率63%)を得た。

10 融点 120-122℃。

対応する出発原料を用い、実施例341と同様にして、実施例342及び実施 · 例343の化合物を製造した。

実施例342

4-[2-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-

15 b] オキサゾールー2ーイル) エチル] ピペラジンー1ーカルボン酸4ートリフ ルオロメチルベンジルエステル

微黄色粉末、収率 6 8 %、融点 1 3 9 − 1 4 0 °C。

実施例343

4-[3-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-

20 b] オキサゾールー2ーイル) プロピル] ピペラジンー1ーカルボン酸4ートリ フルオロメチルベンジルエステル

微黄色粉末、収率57%、融点 130-133℃。

実施例344

4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキ 25 サゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸3-(4-トリフルオ ロメチルフェニル) -2-プロピニルエステル・マレイン酸塩の製造

実施例306で製造した2- (4-tert-ブトキシカルボニルピペラジン-1-イル)メチルー2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(220mg、0.6ミリモル)、トリフルオロ酢酸(1

m1)及び塩化メチレン(2m1)の混合物を室温下にて2時間撹拌した。反応液を減圧下にて濃縮した。残渣を塩化メチレン2m1に溶解し、トリエチルアミン(1m1、7. 17ミリモル)を加え中和した。得られる中和液を減圧下にて濃縮し、残渣をDMF(2m1)に溶解した。

一方、3-(4-トリフルオロメチルフェニル) -2-プロピン-1-オール (110m、0.55ミリモル)、1,1'-カルボニルジイミダゾール (90mg、0.55ミリモル)及びDMF (2m1)の混合物を室温下にて2時間撹拌し、活性エステルを調製した。

この活性エステルを先のDMF溶液に加え、室温下にて終夜撹拌した。反応液 10 に水を加え、酢酸エチルにより2回抽出した。有機相を合わせ、2回水洗後、飽 和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=5/1)により精製した。

得られたフリー体をエタノール5m1に溶解し、これにマレイン酸(96mg、150.83ミリモル)をエタノール(5m1)に溶解した溶液を加えた。析出晶を濾取することにより、白色粉末の4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロピニルエステル・マレイン酸塩(227mg、収率68%)を得た。

20 融点 166℃ (分解)。

実施例345

4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸4-メチルスルファニルベンジルエステルの製造

実施例306で製造した2-(4-tert-ブトキシカルボニルピペラジン-1-イル)メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(900mg、2.4ミリモル)及びトリフルオロ酢酸(20m1)の混合物を室温下にて2時間撹拌した。反応液を減圧下にて濃縮した。残渣を塩化メチレン20m1に溶解し、トリエチルアミン(6m1、43.

05ミリモル)を加え中和した。減圧下にて濃縮した。残渣をDMF (5ml)に溶解した。

一方、4-メチルスルファニルベンジルアルコール(470 mg、3 ミリモル)、1, 1, -カルボニルジイミダゾール(500 mg、3. 1 ミリモル)及びDMF(10 m 1)の混合物を室温下にて3時間撹拌し、活性エステルを調製した。

この活性エステルを先のDMF溶液に加え、室温下にて終夜撹拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルにより2回抽出した。有機相を合わせ、2回水洗後、飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下10 にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=20/1)により精製し、白色粉末の4-(2-メチル-6-ニトロー2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸4-メチルスルファニルベンジルエステル(860mg、収率79%)を得た。

15 融点 118-120℃。

実施例346

4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸4-メタンスルフィニルベンジルエステルの製造

20 実施例345で製造した4-(2-メチルー6-ニトロー2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールー2-イルメチル)ピペラジンー1ーカルボン酸4-メチルスルファニルベンジルエステル(300mg、0.67ミリモル)及び塩化メチレン(10ml)の混合物に、氷冷下にてmークロロ過安息香酸(210mg、0.85ミリモル)を加え、同温度下にて2時間撹拌した。反25 応液を飽和亜硫酸ナトリウム水溶液、飽和重曹水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をイソプロピルアルコール/エーテルから再結晶し、白色粉末の4-(2-メチルー6-ニトロー2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールー2ーイルメチル)ピペラジンー1ーカルボン酸4-メタンスルフィニルベンジルエステ

ル (203mg、収率65%) を得た。

融点 117-121℃。

実施例347

4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキ 5 サゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸4-ヒドロキシベンジルエステルの製造

4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オ

キサゾールー2ーイルメチル)ピペラジンー1ーカルンボン酸4ー(tertーブチルジメチルシラニロキシ)ベンジルエステル(400mg、0.75ミリモ10 ル)及びTHF(10ml)の混合物に、氷冷下にてテトラブチルアンモニウムフロリド(1M)THF溶液(0.8ml、0.8ミリモル)を加え、同温度下にて20分撹拌した。反応液に酢酸エチルを加え、飽和塩化アンモニウム水溶液、水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。

濾液を減圧下にて濃縮した。残渣にジエチルエーテルを加え、析出晶を濾取する

15 ことにより、微黄色粉末の4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸4-ヒドロキシベンジルエステル (95mg、収率30%) を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 59 (3H, s), 2. 30-2. 70 (4H, m), 2. 56 (1H, d, 20 J=15. 0Hz), 2. 86 (1H, d, J=15. 0Hz), 3. 10-3. 55 (4H, m), 3. 91 (1H, d, J=10. 0Hz), 4. 28 (1H, d, J=10. 0Hz), 5. 03 (2H, s), 5. 30 (1H, brs), 6. 84 (2H, d, J=8. 0Hz), 7. 24 (2H, d, J=8. 0Hz), 7. 53 (1H, s).

25 実施例348

4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸4-アセチルベンジルエステルの製造

4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オ

キサゾールー2ーイルメチル)ピペラジンー1ーカルンボン酸4ー(1,1ージメトキシエチル)ベンジルエステル(600mg、1.23ミリモル)、1規定塩酸10ml(10ミリモル)及びTHF(15ml)の混合物を室温下にて2時間撹拌した。飽和重曹水を加えて中和し、酢酸エチルにより抽出した。水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣にジエチルエーテルを加え、析出晶を濾取することにより、白色粉末の4ー(2ーメチルー6ーニトロー2,3ージヒドロイミダゾ[2,1ーb]オキサゾールー2ーイルメチル)ピペラジンー1ーカルボン酸4ーアセチルベンジルエステル(558mg、収率99%)を得た。

10 融点 101-102℃。

実施例349

4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸4-ベンゾイルベンジルエステルの製造

15 4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルンボン酸4-(ジメトキシーフェニルメチル) ベンジルエステル(800mg、1. 45ミリモル) を用い、実施例348の方法により、白色粉末の4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン20 -1-カルボン酸4-ベンゾイルベンジルエステル(630mg、収率86%)を得た。

融点 105-107℃。

実施例350

4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキ 25 サゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸4-アミノベンジルエ ステルの製造

4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オ キサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルンボン酸4-(tert-ブトキシカルボニルアミノ)ベンジルエステル(340mg、0.66ミリモ

ル)、トリフルオロ酢酸2ml及び塩化メチレン(10ml)の混合物を室温下にて2時間撹拌した。反応液に飽和重曹水を加えて中和し、分液後、水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣にジエチルエーテルを加え、析出晶を濾取することにより、

6 微黄色粉末の4-(2-メチルー6-ニトロー2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールー2ーイルメチル)ピペラジンー1ーカルボン酸4ーアミノベンジルエステル(100mg、収率37%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 61 (3H, s), 2. 35-2. 70 (4H, m), 2. 56 (1H, d, J=15. 0Hz), 2. 85 (1H, d, J=15. 0Hz), 3. 05-3. 55 (4H, m), 3. 69 (2H, brs), 3. 91 (1H, d, J=10. 0Hz), 4. 28 (1H, d, J=10. 0Hz), 4. 98 (2H, s), 6. 55 (2H, d, J=8, 0Hz), 7. 14 (2H, d, J=8. 0Hz), 7. 53 (1H. s)

15 実施例351

4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸フェニルアミド塩酸塩の製造

実施例306で製造した2-(4-tert-ブトキシカルボニルピペラジン20-1-イル)メチルー2-メチルー6-ニトロー2,3-ジヒドロイミダブ[2,1-b]オキサゾール(130mg、0.35ミリモル)及びトリフルオロ酢酸(3m1)の混合物を室温下にて終夜撹拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣を塩化メチレン3mlに溶解し、トリエチルアミン(2ml、14.35ミリモル)を加えた。この液にフェニルイソシアネート(63mg、0.53ミリモル)を加え、室温下にて30分撹拌した。反応液に水を加え、塩化メチレンにより抽出し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=50/1)により精製し、アモルファスを得た。

このアモルファスを酢酸エチルに溶解し、飽和塩酸/酢酸エチル溶液を加える

ことにより得られる結晶を濾取し、微黄色粉末結晶の4-(2-メチル-6-1)トロー2、3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸フェニルアミド塩酸塩(124 m g、収率55 %)を得た。

- 5 1 H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:
 - 1. 55 (3H, s), 2. 50-2, 56 (4H, m), 2. 75 (2H,
 - s), 3. 21-3. 40 (4H, m), 4. 05 (1H, d, J=10. 7
 - Hz), 4. 24 (1H, d, J=10.7Hz), 6. 92-6. 99 (1H,
 - m), 7. 21-7. 28 (2H, m), 7. 44-7. 48 (2H, m), 8.
- 10 13 (1H, s), 8. 59 (1H, s).

実施例352

4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸イソプロピルアミドの製造

- 15 実施例306で製造した4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダブ[2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸tertーブチルエステル(140mg、0.38ミリモル) 及びトリフルオロ酢酸(3ml)の混合物を室温下にて終夜撹拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣を塩化メチレン3mlに溶解し、トリエチルアミン(2ml、14.
- 20 35ミリモル)を加えた。この液にイソプロピルイソシアネート(75μ 1、0.76ミリモル)を加え、室温下にて1時間撹拌した。反応液に水を加え、塩化メチレンにより抽出し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=50/1)により精製し、白色粉末の4-(2-メチル-6-ニ
- 25 トロー2, 3 ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2 ーイルメチル) ピペラジンー1 カルボン酸イソプロピルアミド (90mg、収率67%) を得た。

融点 175-176.3℃。

対応する出発原料を用い、実施例352と同様にして、実施例353及び実施

例354の化合物を製造した。

実施例353

4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸(3-クロロフェニ

5 ル) アミド

 $^{1}H-NMR$ (DMSO-d₆) δ ppm:

1. 56 (3H, s), 2. 50-2. 56 (4H, m), 2. 77 (2H, s), 3. 21-3. 40 (4H, m), 4. 08 (1H, d, J=10. 7 Hz), 4. 26 (1H, d, J=10. 7 Hz), 6. 95 (1H, bd, J=10.

10 = 8. 0Hz), 7. 23 (1H, t, J=8. 0Hz), 7. 36 (1H, bd, J=8. 0Hz), 7. 61 (1H, t, J=2. 0Hz), 8. 13 (1H, s), 8. 61 (1H, s).

実施例354

4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキ 15 サゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸シクロヘキシルアミド 融点 216.5-218.5℃。

実施例355

4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボチオ酸(4-クロロフェニ

20 ル) アミドの製造

実施例322で製造した2-メチルー6-ニトロー2ー(ピペラジンー1ーイルメチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール・二塩酸塩(196mg、0.73ミリモル)を塩化メチレン10mlに懸濁し、トリエチルアミン(0.27ml、1.94ミリモル)を加え、均一化させた。これに4-クロロフェニルイソチオシアネート(140mg、0.83ミリモル)を加え、室温下にて1時間撹拌した。反応液を水洗後、飽和重曹水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=30/1)により精製し、淡茶粉末の4-(2-メチルー6-ニトロ-2,3-ジヒ

ドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー 2 ーイルメチル) ピペラジンー 1 ーカルボチオ酸(4 ークロロフェニル)アミド(128 mg、収率 40%)を得た。融点 204 -206 $^{\circ}$ $^{\circ}$ (分解)。

対応する出発原料を用い、実施例355と同様にして、実施例356及び実施 5 例357の化合物を製造した。

実施例356

4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボチオ酸フェニルアミド 融点 164-165 \mathbb{C} (分解)。

10 実施例 3 5 7

4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボチオ酸 (4-メトキシフェニル) アミド

融点 189-191℃ (分解)。

15 実施例358

2-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル] ベンゾオキサゾールの製造

実施例306で製造した2-(4-tert-ブトキシカルボニルピペラジン20 -1-イル)メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(500mg、1.36ミリモル)をトリフルオロ酢酸(10ml)に溶解し、3時間室温で撹拌した。反応液を減圧下に濃縮し、塩化メチレン、トリエチルアミンを1mlずつ加えた。次いでこれを室温で5分撹拌した後、減圧下濃縮した。残渣を塩化メチレンに溶解し、2-クロロベンゾオキセグール(0.19ml 1.63ミリモル)及びトリエチルアミン(0.23ml、1.63mミリモル)を加え、室温で1時間撹拌した。反応液を水に注ぎ、塩化メチレンで抽出した。飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=100/1)で精製し、塩化メチレン

 $5 \text{ MS } 384 \text{ (M}^+\text{)}$

融点 228.0-229.5℃。

対応する出発原料を用い、実施例358と同様にして、実施例359〜実施例361の化合物を製造した。

実施例359

10 2-[4-(6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2-イルメチル) ピペラジン-1-イル] ベンゾオキサゾール白色粉末、収率74%

 $MS = 370 (M^{+})$

融点 206-209℃ (分解)。

15 実施例 3 6 0

白色粉末、収率73%

 $20 \text{ MS} 398 (\text{M}^+)$

融点 187.6-189.6℃。

実施例361

 $2-\{4-[3-(2- imes imes imes imes -2-1-2, 3- imes imes imes imes imes [2, 1-b] オキサゾールー2ーイル) プロピル] ピペラジンー<math>1- imes imes$

25 キサゾール

白色粉末、収率90%

 $MS 412 (M^{+})$

融点 172.0-174.4℃。

実施例362

(S) $-4-[3-(2-\rho pp-4-z] -4-z] -4-z$ と $(2-\rho pp-4-z] -4-z$ と $(2-\rho pp-4-z] -4-z$ と $(2-\rho pp-4-z) -2-z$ と (2

実施例 8で製造した (R) -2 - 0 - 1 -メチルベンゼンスルホニルオキシ)プロピル]-4-ニトロイミダゾール(16. 86g、44.86ミリモル) 及びピペラジン-1-カルボン酸tertーブチ ルエステル(8.36g、44.89ミリモル)をアセトニトリル(100 m1) に溶解し、これにトリエチルアミン(6.3ml、45.2ミリモル)を 加え、6時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に 水(100ml)を加え、酢酸エチル(100ml)で2回抽出した。有機相を 10 合わせ、水(100ml)、飽和食塩水(100ml)の順に洗浄し、硫酸ナト リウムで乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカ ラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=40/1)にて精製した。 酢酸エチル/n-ヘキサンから再結晶し、微黄色粉末結晶の(S)-4-[3-(2-クロロー4-ニトロイミダゾールー1-イル) -2-ヒドロキシプロピ 15 ル] ピペラジン-1-カルボン酸 t e r t - ブチルエステル (11.61g、収 率66%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 46 (9H, s), 2. 21-2. 50 (4H, m), 2. 54-2. 70 20 (2H, m), 3. 39-3. 48 (4H, m), 3. 65 (1H, s), 3. 89-4. 10 (2H, m), 4. 20 (1H, dd, J=1. 9Hz, 13. 5Hz), 8. 00 (1H, s).

実施例363

 (S) -4-[3-(2-クロロー4ーニトロイミダゾールー1ーイル) -2 25 ヒドロキシプロピル] ピペラジンー1ーカルボン酸tertーブチルエステルの 製造(実施例362の化合物の別途合成法)

実施例 9 で製造した(R) -2 - 2 - 1 -

(3 m l) の混合物を 7.0 $^{\circ}$ $^{\circ}$ にて 6 時間撹拌した。反応液を室温に戻し、水 7 m l を加え、析出晶を濾取した。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール= 4.0/1)にて精製し、微黄色粉末結晶の(S) -4-[3-(2-2)-4-2] にてオーニー・ロイミダゾールー 1-4 に 1

実施例364

10 製造

2-クロロー4-ニトロー1H-イミダゾール (6.1g、41.35ミリモル)、(S)-(+)-グリシジルトシレート (12.27g、53.75ミリモル)及び炭酸水素ナトリウム (7.3g、86.89ミリモル)のエタノール (30ml)中の混合物を9時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、水を加え、

- 15 塩化メチレンで2回抽出した。抽出溶液を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、濾過した。濾液を濃縮して得られたフォームをDMF(60ml)に溶解した。この溶液に、ピペラジン-1-カルボン酸tertーブチルエステル(8.47g、45.48ミリモル)、トリエチルアミン(6.92m、49.64ミリモル)及びヨウ化ナトリウム(6.82g、45.5ミリモル)
- 20 を加え、室温で24時間撹拌した。反応液を水中に注ぎ、酢酸エチルで2回抽出した。有機相を合わせ、3回水洗し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル)で精製して、微黄色オイルの(R)-4-[3-(2-クロロー4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシプロピル]ピペラジンー
- - 1. 48 (9H, s), 2. 16-2. 50 (4H, m), 2. 55-2. 69 (2H, m), 3. 37-3. 50 (4H, m), 3. 65 (1H, s), 3. 90-4. 25 (3H, m), 8. 00 (1H, s).

実施例365

- (S) -4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-ヒドロキシー2-メチルプロピル] ピペラジン-1-カルボン酸 t e r t ーブチ ルエステルの製造
- 実施例12で製造した(R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラ 5 ニルメチル) -4-ニトロイミダゾール (7.00g、32.2ミリモル) 及び ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(6.29g、33.8 ミリモル)のDMF(70ml)中の混合物を70℃にて8時間撹拌した。反応 液を室温に戻し、水を加え、酢酸エチルにより2回抽出した。有機相を合わせ、
- 3回水洗し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃 10 縮した。残渣にジエチルエーテルを加え、得られる結晶を濾取した。室温下にて 減圧乾燥することにより微黄色粉末結晶の(S)-4-[3-(2-クロロ-4ーニトロイミダゾールー1ーイル) -2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル] ピ ペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (10.25g、収率79 %) を得た。

光学純度 > 98.4%ee

15

 $\lceil \alpha \rceil D^{27} = 25.488$ (濃度: 1.024, CHCl₃)

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 14 (3H, s), 1. 46 (9H, s), 2. 34 (1H, d, J=13.

- $9 \, Hz$), 2. 47 2. 67 (5 H, m), 3. 26 (1 H, s), 3. 4420 (4H, t, J=4.4Hz), 3.99 (2H, s), 8.04 (1H, s)実施例366
- (S) -4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-ヒドロキシー2-メチルプロピル] ピペラジン-1-カルボン酸 t e r t ーブチ 25 ルエステルの製造 (実施例365の化合物の別途合成法)

2-クロロー4-ニトロー<math>1 Hーイミダゾール(89.4g、606ミリモ ル)及び(S)-4-(2-メチルオキシラニルメチル)ピペラジン-1-カル ボン酸 t e r t ーブチルエステル (119g、466ミリモル) をエタノール (475ml) に溶解し、炭酸水素ナトリウム (58.7g、699ミリモル)

を加えて6時間加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、残渣に水を加え、酢酸エチルで抽出した。抽出溶液を硫酸ナトリウムで乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮することによって得られた結晶を酢酸エチルで分散洗浄後、濾取して一次晶を得た。母液を濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(nーペキサン/アセトン=3/1)にて精製し、二次晶を得た。一次晶と二次晶とをあわせ減圧乾燥し、白色粉末結晶の(S)-4-[3-(2-クロロー4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]ピペラジン-1-カルボン酸

tertーブチルエステル(84.7g、収率45%)を得た。

10 実施例367

 $(R) - 4 - [3 - (2 - \rho \mu - 4 - \mu - 1 - 4 \mu - 1 - 4 \mu - 2 \mu -$

実施例18で製造した(S) -2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラ15 ニルメチル) -4-ニトロイミダゾール(440mg、2.02ミリモル)、ピペラジン-1-カルボン酸tertーブチルエステル(414mg、2.22ミリモル)及びDMF(4ml)の混合物を55-60℃にて9時間撹拌した。反応液を室温に戻し、水(24ml)を加え、酢酸エチル(10ml)で2回抽出した。有機相を合わせ、水(20ml)で3回洗浄後、飽和食塩水(10ml)

- 20 で洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濾過した。濾液を減圧濃縮し、残渣をジエチルエーテル処理して得られる結晶を濾取し、微黄色粉末結晶の(R)-4-[3-(2-クロロー4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシー2-メチルプロピル]ピペラジン-1-カルボン酸tertーブチルエステル(662mg、収率81%)を得た。
- 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1. 15 (3H, s), 1. 45 (9H, s), 2. 34 (1H, d, J=13. 9Hz), 2. 48-2. 67 (5H, m), 3. 27 (1H, s), 3. 44 (4H, t, J=4. 4Hz), 3. 99 (2H, s), 8. 04 (1H, s)。 2-クロロー4-ニトロー1H-イミダゾール及び (R) -4- (2-メチル -2-オキシラニルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸 t e r t ーブチルエステルを用い、実施例366と同様にして、実施例368の化合物を製造した。 実施例368

(R) -4-[3-(2-クロロー4-ニトロイミダゾールー1-イル) -2-ヒドロキシー2-メチルプロピル] ピペラジンー1-カルボン酸 tertーブチ ルエステル (実施例367の化合物の別途合成法)

白色粉末結晶、収率20%。

実施例369

- (S) -1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル) -4-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン(0.43g、1.37ミリモル)及び2-クロロ-4-ニトロー1Hーイミダゾール(0.22g、1.51ミリモル)の

 15 アセトニトリル(4m1) 懸濁液に炭酸水素ナトリウム(0.17g、2.06ミリモル)を加え、9時間加熱還流した。反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出し、硫酸マグネシムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=3/1)により精製し、微黄色油状物の(S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチルー3-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペラジン-1-イル]

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

プロパン-2-オール(0.20g、収率31%)を得た。

1. 18 (3H, s), 2. 41 (1H, d, J=13.8Hz), 2. 56 (1H, d, J=13.8Hz), 2. 67-2. 80 (2H, m), 2. 85

25 -2.96 (2H, m), 3.13-3.25 (4H, m), 4.03 (2H, s), 6.83-6.93 (2H, m), 7.07-7.17 (2H, m), 8.07 (1H, s).

実施例370

-3-[4-(4-クロロフェニル) ピペラジン<math>-1-イル] プロパン-2-オールの製造

実施例12で製造した(R) -2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル) -4-ニトロイミダゾール(20g、91.9ミリモル)及び1-5 (4-クロロフェニル)ピペラジン(20.8g、0.11モル)をDMF(20ml)に加え、70-75℃にて5時間撹拌した。反応液を室温に戻し、水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=20/1)により精製し、黄色アモルファスの(S) -1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 53 (3H, s), 2. 42 (1H, d, J=13. 9Hz), 2. 55

15 (1H, d, J=13. 9Hz), 2. 67-2. 76 (2H, m), 2. 81

-2. 90 (2H, m), 3. 13-3. 17 (4H, m), 3. 43 (1H, s), 4. 03 (2H, s), 6. 78-6. 85 (2H, m), 7. 16-7. 23 (2H, m), 8. 06 (1H, s).

対応する出発原料を用い、実施例370と同様にして、次表に示す実施例37 20 1~実施例384の化合物を製造した。 表17

5

	実施例	R	収率 (%)	'H NMR (CDCl ₃) δ
10	371	4-CF ₃	82	1.18(3H, s), 2.41(1H, d, J=13.9Hz), 2.56(1H, d, J=13.9Hz), 2.68-2.79(2H, m), 2.82-2.91(2H, m), 3.26-3.31(5H, m), 4.03(2H, s), 6.91(2H, d, J=8.7Hz), 7.49(2H, d, J=8.7Hz), 8.06(1H, s).
	372	4-H	92	1.17(3H, s), 2.40(1H, d, J=13.9Hz), 2.55(1H, d, J=13.9Hz), 2.69·2.78(2H, m), 2.83·2.91(2H, m), 3.18·3.22(4H, m), 3.42(1H, s), 4.01(2H, s), 6.85·6.93(3H, m), 7.24·7.31(2H, m), 8.06(1H, s).
	373	4-F	43	1.16(3H, s), 2.41(1H, d, J=13.9Hz), 2.55(1H, d, J=13.9Hz), 2.69-2.77(2H, m), 2.82-2.91(2H, m), 3.10-3.14(4H, m), 3.41(1H, s), 4.01(2H, s), 6.83-7.00(4H, m), 8.06(1H, s).
	374	4-OMe	99	1.15(3H, s), 2.42(1H, d, J=13.9Hz), 2.55(1H, d, J=13.9Hz), 2.69-2.78(2H, m), 2.82-2.91(2H, m), 3.07-3.11(4H, m), 3.77(3H, s), 4.02(2H, s), 6.81-6.91(4H, m), 8.07(1H, s).
15	375	4-COOEt	100	1.17(3H, s), 1.37(3H, t, J=7.1Hz), 2.42(1H, d, J=13.9Hz), 2.55(1H, d, J=13.9Hz), 2.68-2.76(2H, m), 2.81-2.89(2H, m), 3.31-3.35(4H, m), 3.40(1H, s), 4.04(2H, s), 4.33(2H, q, J=7.1Hz), 6.83-6.87(2H, m), 7.90-7.95(2H, m), 8.06(1H, s).
	376	4-Me	43 99 3 6 6 6 6 6 6 6 6 6 6 6 6 6 6 6 6 6	1.15(3H, s), 2.27(3H, s), 2.41(1H, d, J=13.9Hz), 2.55(1H, d, J=13.9Hz), 2.68-2.77(2H, m), 2.82-2.90 (2H, m), 3.12-3.16(4H, m), 3.47(1H, s), 4.01(2H, s), 6.81-6.85(2H, m), 7.06-7.09(2H, m), 8.06(1H, s).
20	377	4-CN	99	1.18(3H, s), 2.43(1H, d, J=13.9Hz), 2.56(1H, d, J=13.9Hz), 2.66-2.75(2H, m), 2.81-2.90(2H, m), 3.31-3.35(4H, m), 3.51(1H, s), 4.03(1H, d, J=14.3Hz), 4.09(1H, d, J=14.3Hz), 6.82-6.88(2H, m), 7.46-7.52(2H, m), 8.07(1H, s).
	378	3,4-di-Cl	99	1.17(3H, s), 2.41(1H, d, J=13.9Hz), 2.55(1H, d, J=13.9Hz), 2.68-2.76(2H, m), 2.80-2.89(2H, m), 3.15-3.19(4H, m), 3.40(1H, s), 4.03(2H, s), 6.72(1H, dd, J=8.9, 2.9Hz), 6.94(1H, d, J=2.9Hz), 7.28(1H, d, J=8.9Hz), 8.05(1H, s).
25	379	3-CF ₃	99	1.17(3H, s), 2.42(1H, d, J=13.9Hz), 2.56(1H, d, J=13.9Hz), 2.69-2.78(2H, m), 2.83-2.93(2H, m), 3.22-3.27(4H, m), 3.36(1H, s), 4.03(2H, s), 7.03-7.11(3H, m), 7.32-7.39(1H, m), 8.06(1H, s).

25

5

10

380	$2 ext{-}\mathbf{CF_3}$	99	1.16(3H, s), 2.44(1H, d, J=14.0Hz), 2.57(1H, d, J=14.0Hz), 2.67-2.78(2H, m), 2.81-2.91(2H, m), 2.93-2.96(4H, m), 3.81(1H, s), 4.05(2H, s), 7.21-7.27(1H, m), 7.35-7.39(1H, m), 7.50-7.57(1H, m), 7.60-7.64(1H, m), 8.11(1H, s).
381	4-Cl-3-CF ₃	99	1.18(3H, s), 2.42(1H, d, J=13.9Hz), 2.56(1H, d, J=13.9Hz), 2.68-2.77(2H, m), 2.83-2.92(2H, m), 3.19-3.24(4H, m), 3.40(1H, s), 4.04(2H, s), 6.95(1H, dd, J=8.9, 2.9Hz), 7.16(1H, d, J=2.9Hz), 7.34(1H, d, J=8.9Hz), 8.06(1H, s).
382	4-COO ^t Bu	99	1.17(3H, s), 1.57(9H, s), 2.42(1H, d, J=13.9Hz), 2.55(1H, d, J=13.9Hz), 2.67-2.76(2H, m), 2.81-2.90(2H, m), 3.29-3.33(4H, m), 3.51(1H, s), 4.04(2H, s), 6.84(2H, d, J=9.0Hz), 7.87(2H, d, J=9.0Hz), 8.07(1H, s).
383	2-F	99	1.16(3H, s), 2.42(1H, d, J=13.9Hz), 2.57(1H, d, J=13.9Hz), 2.71-2.80(2H, m), 2.85-2.96(2H, m), 3.10-3.14(4H, m), 3.56(1H, s), 4.02(2H, s), 6.91-7.10(4H, m), 8.07(1H, s).
384	4-NMe ₂	82	1.14(3H, s), 2.40(1H, d, J=13.9Hz), 2.54(1H, d, J=13.9Hz), 2.70·2.77(2H, m), 2.81·2.91(8H, m), 3.05·3.09(4H, m), 3.66(1H, s), 4.01(2H, s), 6.72·6.76(2H, m), 6.86·6.91(2H, m), 8.07(1H, s).

対応する出発原料を用い、実施例370と同様にして、実施例385及び実施例386の化合物を製造した。

実施例385

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 18 (3H, s), 2. 44 (1H, d, J=13.9Hz), 2. 56

20 (1H, d, J=13.9Hz), 2. 63-2.73 (2H, m), 2. 77

-2.91 (2H, m), 3.31-3.35 (4H, m), 3.54 (1H,

s), 4. 03-4. 12 (2H, m), 6. 63-6. 66 (2H, m), 8.

0.9 (1 H, s), 8.23-8.27 (2 H, m)

実施例386

25 (S) $-1-(2-\rho$ ロロー4ーニトロイミダゾール-1-イル) -2-メチル -3-[4-(3-ピリジル) ピペラジン-1-イル] プロパン-2-オール 収率 $8\,$ 1%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 17 (3H, s), 2. 44 (1H, d, J = 13.9 Hz), 2. 57

(1H, d, J=13.9Hz), 2.67-2.79 (2H, m), 2.84
-2.93 (2H, m), 3.20-3.25 (4H, m), 3.85 (1H, bs), 4.06 (2H, s), 7.16-7.19 (2H, m), 8.078.11 (2H, m), 8.26-8.28 (1H, m).

5 実施例 9 で製造した (R) -2-クロロ-4-ニトロ-1- (2-オキシラニルメチル) イミダゾールを用い、実施例 3 7 0 と同様にして、実施例 3 8 7 ~実施例 3 8 9 の化合物を製造した。

実施例387

- 10 (4-フルオロフェニル) ピペラジン-1-イル] プロパン-2-オール 収率86%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

- 2. 27-2. 36 (1H, m), 2. 49-2. 63 (3H, m), 2. 78 -2. 88 (2H, m), 2. 97-3. 18 (4H, m), 3. 74 (1H,
- 15 br), 3. 96-4. 08 (2H, m), 4. 18-4. 24 (1H, m), 6. 84-7. 01 (4H, m), 8. 02 (1H, s).

実施例388

- 20 ール

収率49%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

- 2. 27-2. 36 (1H, m), 2. 49-2. 63 (3H, m), 2. 78 -2. 87 (2H, m), 3. 28-3. 31 (4H, m), 3. 62 (1H,
- 25 br), 3. 95-4. 11 (2H, m), 4. 19-4. 25 (1H, m), 6. 92 (2H, d, J=8. 6Hz), 7. 49 (2H, d, J=8. 6 Hz), 8. 02 (1H, s).

実施例389

(S) $-1-(2-\rho - 1 - 4$

(4-シアノフェニル) ピペラジン-1-イル] プロパン-2-オール 収率100%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

2. 28-2. 37 (1H, m), 2. 49-2. 63 (3H, m), 2. 765 -2. 85 (2H, m), 3. 28-3. 36 (4H, m), 3. 58 (1H, br), 3. 96-4. 12 (2H, m), 4. 19-4. 25 (1H, m), 6. 87 (2H, d, J=8. 9Hz), 7. 51 (2H, d, J=8. 9Hz), 8. 01 (1H, s).

実施例390

15

10 (S) -4-[3-(2-クロロー4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-ヒドロキシー2-メチルプロピル] ピペラジン-1-カルボン酸4-トリフルオロメトキシベンジルエステルの製造

実施例12で製造した(R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール(15g, 68, 93ミリモル)及びピペラジン-1-カルボン酸4-トリフルオロメトキシベンジルエステル(25,

- 17g、82.72ミリモル)とをDMF75ml中、65-70℃にて20時間撹拌した。反応液を室温に戻し、酢酸エチル150ml及び水475ml中に注ぎ、分液した。更に水層より酢酸エチル150mlにより抽出した。有機相を合わせ、水400mlにより3回洗浄後、飽和食塩水100mlにより洗浄し、
- 20 硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル/nーヘキサン=1/2)により精製し、黄色オイルの(S)-4-[3-(2-クロロー4-ニトロイミダゾールー1ーイル)-2-ヒドロキシー2-メチルプロピル]ピペラジン-1ーカルボン酸4ートリフルオロメトキシベンジルエステル(29.98g、収率25 83%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 15 (3H, s), 2. 36 (1H, d, J=14.0Hz), 2. 42-2. 75 (5H, m), 3. 18 (1H, s), 3. 42-3. 58 (4H, m), 4. 00 (2H, s), 5. 12 (2H, s), 7. 21 (2H, d, J

 $= 8.6 \,\mathrm{Hz}$), 7.38 (2H, d, J=8.6Hz), 8.03 (1H, s).

実施例391

(S) -4-[3-(2-クロロー4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-5 ヒドロキシー2ーメチルプロピル] ピペラジン-1ーカルボン酸3-(4ートリフルオロメチルフェニル) -2-プロペニルエステルの製造

実施例12で製造した(R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール(4.24g、19.48ミリモル)及びピペラジン-1-カルボン酸3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-

- 10 プロペニルエステル(6.73g、21.41ミリモル)をDMF21ml中、 50-55℃にて24時間撹拌した。反応液を室温に戻し、酢酸エチル60ml 及び水90ml中に注ぎ、分液した。更に水層より酢酸エチル60mlにより抽 出した。有機相を合わせ、水90mlにより3回洗浄後、飽和食塩水60mlに より洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃
- 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1. 16 (3H, s), 2. 36 (1H, d, $J = 14.0 \,\mathrm{Hz}$), 2. 43-

2. 76 (5H, m), 3. 17 (1H, s), 3. 48-3. 67 (4H,

m), 4.00 (2H, s), 4.78 (2H, dd, J=1.0Hz, 6.1

Hz), 6. 33-6. 48 (1H, m), 6. 66 (1H, d, J=15. 9

25 Hz), 7. 48 (2H, d, J=8. 3Hz), 7. 58 (2H, d, J=8. 3Hz), 8. 04 (1H, s).

対応する出発原料を用い、実施例391と同様にして、実施例392の化合物 を製造した。

実施例392

(S) $-4-[3-(2-\rho -4-1)-4-1]$ ピペラジン $-1-\mu$ ルボン酸 3-(4-1)フルオロメトキシフェニル) $-2-\mu$ ロペニルエステル

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

- 5 1. 15 (3H, s), 2. 36 (1H, d, J=13. 9Hz), 2. 51 (1H, d, J=13. 9Hz), 2. 48-2. 63 (2H, m), 2. 63 -2. 78 (2H, m), 3. 17 (1H, s), 3. 39-3. 63 (4H, m), 4. 00 (2H, s), 4. 75 (2H, dd, J=1. 1Hz, 6. 3 Hz), 6. 28 (1H, dt, J=6. 3Hz, 15. 9Hz), 6. 62
- 10 (1H, d, J=15. 9Hz), 7. 15-7. 18 (2H, m), 7. 38 -7. 42 (2H, m), 8. 03 (1H, s).

実施例393

15

(S) -4-(2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル) ピペラジンー<math>1-カルボン酸tertーブチルエステルの製造

実施例 365で製造した(S) $-4-[3-(2-\rho pp -4- hp -4- hp -4 + hp -4 +$

20 9ミリモル)を加え、同温度下にて2時間撹拌した。反応液に酢酸エチル(10 m1)及び水(70m1)を加え、析出する結晶を濾取し、水洗した。この粗結晶を酢酸エチル(70m1)から再結晶して、微黄色粉末結晶の(S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル25 (6.62g、収率71%)を得た。

光学純度 >99.5%ee

 $[\alpha]$ D²⁷=-20.953° (濃度:0.492, CHC1₃) ¹H-NMR (CDC1₃) δ p p m:

1. 44 (9 H, s), 1. 62 (3 H, s), 2. 45-2. 66 (5 H, s)

m), 2. 87 (1H, d, J=14.9Hz), 3. 29 (4H, br), 3. 92 (1H, d, J=9.7Hz), 4. 30 (1H, d, J=9.7Hz), 7. 53 (1H, s).

実施例394

実施例363で製造した(S)-4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダ ゾール-1-イル)-2-ヒドロキシプロピル] ピペラジン-1-カルボン酸

- 10 tertーブチルエステル(11g、28.22ミリモル)を用い、実施例393と同様の方法により、微黄色粉末結晶の(S)-4-(6-ニトロー2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールー2ーイルメチル)ピペラジンー1ーカルボン酸tertーブチルエステル(7.5g、収率75%)を得た。
 光学純度 96.6%ee
- 15 [α] D²²=-11.91° (濃度:1.016, CHCl₃)

 ¹H-NMR (CDCl₃) δ p p m:

 1.45 (9H, s), 2.49-2.59 (4H, m), 2.85 (2H, d,

 J=5.2Hz), 3.33-3.44 (4H, m), 4.19 (1H, dd,

 J=6.9Hz, 10.2Hz), 4.35 (1H, dd, J=6.9Hz, 1)

 20 0.2Hz), 5.36-5.49 (1H, m), 7.55 (1H, s)。
 - 20 O. 2H2), 5. 36-5. 49 (IH, m), 7. 55 (IH, s)。 実施例395
- 25 実施例364で製造した(R) -4-[3-(2-クロロー4-ニトロイミダ ゾール-1-イル) -2-ヒドロキシプロピル] ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル(6.43g、16.49ミリモル)を1,4-ジオ キサン35mlに溶解し、氷冷下にて水素化ナトリウム(730mg、18.2 5ミリモル)を加え、室温下にて終夜撹拌後、24時間加熱還流した。反応液を

室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に水を徐々に加え、塩化メチレンにより2回抽出し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル)により精製し、白色粉末の(R)-4-(6-ニトロー2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールー2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸tertーブチルエステル(1.23g、収率21%)を得た。

光学純度 >99%ee

率 7 0%) を得た。

[α] $D^{27} = 11.635^{\circ}$ (濃度: 1.004, CHC1₃) ${}^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ p p m:

- 10 1. 45 (9H, s), 2. 50-2. 61 (4H, m), 2. 85 (2H, d, J=5. 3Hz), 3. 31-3. 50 (4H, m), 4. 18 (1H, dd, J=6. 9Hz, 10. 2Hz), 4. 35 (1H, dd, J=8. 4Hz, 10. 2Hz), 5. 35-5. 50 (1H, m), 7. 55 (1H, s)。 実施例396
- 15 (R) -4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

実施例368で製造した(R) -4-[3-(2-クロロー4-ニトロイミダ ゾール-1-イル) -2-ヒドロキシー2-メチルプロピル] ピペラジン-1-20 カルボン酸 tert-ブチルエステル(376 mg、0.93ミリモル)を1,4-ジオキサン(10 ml)に溶解し、氷冷下にて水素化ナトリウム(45 mg、1.12ミリモル)を加え、室温下にて30分撹拌後、24時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に水を徐々に加え、酢酸エチルにより2回抽出し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/アセトン=3/1)により精製し、無色粉末結晶の(R)-4-(2-メチル-6

ーニトロー2, 3 ージヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメ

チル) ピペラジン-1-カルボン酸 t e r t - ブチルエステル (239 mg、収

光学純度 99.2%ee

[α] D²⁷=21.073° (濃度:0.522, CHCl₃)

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 45 (9H, s), 1. 61 (3H, s), 2. 45-2. 64 (5H,

5 m), 2.87 (1H, d, J=14.9Hz), 3.29 (4H, br), 3. 92 (1H, d, J=9.7Hz), 4.33 (1H, d, J=9.7Hz), 7.52 (1H, s).

実施例397

(S) -2-「4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペラジン-1-イ

10 ルメチル] -2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダブ [2, 1-b] オキサゾールの製造

- 15 ル)のTHF(150ml)溶液に氷冷下、水素化ナトリウム(0.66g,18.92ミリモル)を加え、6時間加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、氷冷し、水及び酢酸エチルを加え、析出物を濾取し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(nーヘキサン/酢酸エチル=1/1)により精製し、イソプロパノールから再結晶し、微黄色固体の(S)-2-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニー)
- 20 ル) ピペラジン-1-イル] メチル-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダブ [2, 1-b] オキサゾール (2.58g、収率48%) を得た。 光学純度 99.8%ee

 $[\alpha]_D^{26} = 8.80^{\circ}$ (濃度: 1.000, CHCl₃) 融点 129-130°C。

25 実施例398

実施例370で製造した(S)-1-(2-クロロー4-ニトロイミダゾール

- 5 激しく撹拌した。析出物を濾取して水及び酢酸エチルで洗浄し、減圧乾燥し、淡 黄色粉末の粗製体を23.2g得た。これを同様にもう1回合成した粗製体(5 0g)と合わせ、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エ チル=50/1)により精製し、塩化メチレン-酢酸エチルより結晶化を行い、 白色粉末の(S)-2-[4-(4-クロロフェニル)ピペラジン-1-イルメ
- 10 チル] -2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オ キサゾール (45g、収率90%) を得た。

光学純度 99.6%ee

 $\begin{bmatrix} \alpha \end{bmatrix}_D^{22} = -10.20^{\circ}$ (濃度:0.5, CHC1₃) 融点 218-219.6℃。

15 対応する出発原料を用い、実施例398と同様にして、実施例399〜実施例403の化合物を製造した。

実施例399

- 20 収率42%、 [α] D²⁸=2.10° (濃度:0.5, CHCl₃) 融点178.5-179.5℃。

実施例400

- (S) $-2-[4-(3-l^2 y)]$ $(-2-l^2 y)$ $(-2-l^2 y)$
- 25 収率42%、融点 145-147.7℃。

実施例401

(S) -2-[4-(4-ピリジル) ピペラジン-1-イルメチル] -2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール 収率3%

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

- 1. 65 (3H, s), 2. 62 (1H, d, J=14.8Hz), 2. 64-
- 2. 71 (2H, m), 2. 79-2. 89 (2H, m), 2. 92 (1H, d,

J=14.8Hz), 3. 15-3. 30 (4H, m), 3. 95 (1H, d,

- 5 J=9.7Hz), 4.33 (1H, d, J=9.7Hz),
 - 6. 60 (2H, d, J=6.2Hz), 7. 53 (1H, s), 8. 26 (2H, d, J=6.2Hz).

実施例402

- (S) -2- [4-(4-トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン-1-イル
- 10 メチル] -6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール 融点 175.8-176.6℃。

実施例403

- (S) -2-[4-(4-) アノフェニル) ピペラジン<math>-1-イルメチル] -6 -ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール
- 15 融点 211-211.5℃。

実施例404

20

- 1-(4-クロロフェニル)ピペラジン・二塩酸塩(1.31g、4.86ミリモル)を苛性ソーダ水溶液に投入し、塩化メチレンにより抽出した。抽出液を

硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧濃縮し、1-(4-クロロフェニル)ピペラジンを得た。

- 25 ゾール (763mg、3.75ミリモル)とをDMF (5m1)中、70℃にて6時間撹拌した。反応液を氷冷し、水素化ナトリウム (219mg、5.48ミリモル)を加え、室温下にて2時間撹拌した。反応液に氷水を加え、析出晶を濾取した。これをアセトン/水から再結晶することにより、微黄色粉末結晶の

-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (250 mg、 収率 <math>18%) を得た。

融点 183-183.5℃。

実施例405

5 (S) -4-(2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸4ートリフルオロメトキシベンジルエステルの製造

実施例390で製造した(S)-4-[3-(2-2)-4-2] ジール-1-4ル)-2-2ドロキシ-2-3チルプロピル] ピペラジン-1-4

- 10 カルボン酸 4-トリフルオロメトキシベンジルエステル(4.3g、8.24ミリモル)をDMF(13m1)に溶解し、4 \mathbb{C} まで冷却した。この溶液に水素化ナトリウム(430mg、10.7ミリモル)を加え、同温度下にて2時間撹拌した。反応液に酢酸エチル(4.3m1)、水(30m1)の順に加え、30分撹拌した。析出晶を濾取し、水洗した。これを酢酸エチル/イソプロピルエーテ
- ルから再結晶し、更にイソプロピルアルコールから再結晶することにより、白色 粉末結晶の(S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸4 ートリフルオロメトキシベンジルエステル(3.15g、収率79%)を得た。 融点139.5-140.5℃
- 20 光学純度 > 99.5%ee

 $[\alpha]_D^{27} = 18.04$ °(濃度: 1.020, CHCl₃)

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

- 1. 60 (3H, s), 2. 39-2. 75 (5H, m), 2. 87 (1H, d, J=14. 9Hz), 3. 14-3. 56 (4H, m), 3. 93 (1H, d,
- 25 9. 7Hz), 4. 29 (1H, d, J=9. 7Hz), 5. 10 (2H, s), 7. 19 (2H, d, J=8. 6Hz), 7. 36 (2H, d, J=8. 6 Hz), 7. 54 (1H, s).

実施例406

(S) -4-(2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-

b] オキサゾールー2ーイルメチル) ピペラジンー1ーカルボン酸3- (4-トリフルオロメチルフェニル) -2-プロペニルエステルの製造

実施例391で製造した(S) -4-[3-(2-クロロー4-ニトロイミダ ゾール-1-イル) -2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル] ピペラジン-1-カルボン酔3-(4-トリフルオロスチルフ -1) -2 ポーパース (1.2)

- 10 グラフィー(酢酸エチル)により精製し、微黄色粉末結晶の(S)-4-(2-メチルー6ーニトロー2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールー2ーイルメチル)ピペラジンー1ーカルボン酸3-(4ートリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルエステル(10.17g、収率83%)を得た。融点132-133℃
- 15 光学純度99.0%ee

 $[\alpha]_D^{27} = -21.73^{\circ}$ (濃度: 0.866, CHCl₃)

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

- 1. 62 (3H, s), 2. 48-2. 75 (5H, m), 2. 88 (1H, d, J=14. 9Hz), 3. 15-3. 57 (4H, m), 3. 94 (1H, d,
- 20 J=9. 7Hz), 4. 29 (1H, d, J=9. 7Hz), 4. 75 (2H, d, J=1. 15Hz, 6. 0Hz), 6. 29-6. 42 (1H, m), 6. 64 (1H, d, J=15. 9Hz), 7. 47 (2H, d, J=8. 4Hz), 7. 52-7. 62 (3H, m).

対応する出発原料を用い、実施例406と同様にして、実施例407の化合物 25 を製造した。

実施例407

(S) -4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸 <math>3-(4-トリフルオロメトキシフェニル) -2-プロペニルエステル

融点91-93℃

 $[α]_D^{27} = -21.88°$ (濃度: 0.786, CHCl₃)

7. 40 (2H, d, J=8.7Hz), 7. 53 (1H, s).

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 54 (3H, s), 2, 38-2. 71 (5H, m), 2. 84 (1H, d,

5 J=14.9Hz), 3. 13-3. 54 (4H, m), 3. 92 (1H, d, J=9.7Hz), 4. 29 (1H, d, J=9.7Hz), 4. 73 (2H, dd, J=1.2Hz, 6. 2Hz), 6. 15-6. 33 (1H, m), 6. 60 (1H, d, J=16.0Hz), 7. 16 (2H, d, J=8.7Hz),

10 実施例408

(S) -2-メチル-6-ニトロ-2-(ピペラジン-1-イルメチル) -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール・二塩酸塩の製造

実施例393で製造した(S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1

- 15 ーカルボン酸 t e r t ーブチルエステル (1.46g、3.98ミリモル)をトリフルオロ酢酸 30mlに溶解し、室温下 3時間撹拌した。反応液を減圧下濃縮し、残渣をメタノール 30mlに溶解し、氷冷下、飽和塩化水素の酢酸エチル溶液を徐々に加え、同温度下 30分撹拌した。析出晶を濾取し、黄色粉末の(S)ー2ーメチルー6ーニトロー2ー(ピペラジンー1ーイルメチル)ー2,3ージ
- 20 ヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール・二塩酸塩(994mg、収率73%)を得た。

 1 H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

1. 63 (3H, s), 2. 80-3. 36 (6H, m), 4. 11 (1H, d, J=11. 0Hz), 4. 25-4. 98 (5H, m), 8. 15 (1H, s),

25 9.31 (2H, br).

実施例409

(S) -6-ニトロー2- [4-(4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン-1-イルメチル] -2, 3-ジヒドロイミダゾ <math>[2, 1-b] オキサゾールの製造

実施例3.94で製造した(S)-4-(6-ニトロー2,3-ジヒドロイミダ ゾ [2, 1-b] オキサゾールー2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル(100mg、0. 27ミリモル)及びトリフルオロ 酢酸(2m1)の混合物を室温下にて3時間撹拌した。反応液を減圧下にて濃縮 し、残渣を塩化メチレン5m1に溶解し、トリエチルアミン(1m1、7.17 ミリモル)を加え、中和した。中和液を減圧下にて濃縮し、残渣をメタノール5 mlに溶解し、4-トリフルオロメチルベンズアルデヒド(148mg、0.8 5ミリモル)、シアノトリヒドロホウ酸ナトリウム(53mg、0.85ミリモ u)、酢酸(49μ 1、0.85ミリモル)の順に加え、室温下にて18時間撹 拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣に飽和重曹水を加え、塩化メチレンに 10 より2回抽出した。有機相を合わせ、飽和重曹水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫 酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣を シリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=1/1)に より精製し、微黄色粉末結晶の (S) -6-ニトロ-2- [4-(4-トリフル オロメチルベンジル) ピペラジンー1ーイルメチル] ー2, 3ージヒドロイミダ 15 ゾ [2, 1-b] オキサゾール (53mg、収率46%) を得た。

融点 149-150℃。

実施例410

(S) -2-[4-(4-ビフェニリルメチル) ピペラジン-1-イルメチル]
20 -6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造実施例394で製造した(S) -4-(6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル) ピペラジンー1ーカルボン酸tertーブチルエステル(7.2g、20.26ミリモル)、トリフルオロ酢酸24m1及び塩化メチレン(72m1)の混合物を室温下にて2時間撹拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣を塩化メチレン100m1に溶解し、トリエチルアミン(20m1、143.49ミリモル)を加え、中和した。中和液を減圧下にて濃縮し、残渣をメタノール72m1に溶解し、4-フェニルベンズアルデヒド(7.38g、40.52ミリモル)、シアノトリヒドロホウ酸ナトリウム(3.82g、60.78ミリモル)、酢酸(3.48m1、60.78ミリモ

ル)の順に加え、室温下にて24時間撹拌した。析出晶を濾取し、メタノールにより洗浄した。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=10/1)により精製し、黄色粉末結晶の(S)-2-[4-(4-(4-(2-1)))] により指製し、サールメチル)-6-(2-1) にじつエニリルメチル)ピペラジン-1-(2-1) にドロイミダブ [2, 1-b] オキサゾール(5.52g、収率65%)を得た。光学純度 >99.0%ee

[α]_D²⁸=-28.261° (濃度:0.046, DMSO) 融点 207-208℃。

実施例411

- (R) -2-[4-(4-ビフェニリルメチル) ピペラジン-1-イルメチル] -6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造 実施例395で製造した(R) -4-(6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル) ピペラジン-1ーカルボン酸 tertーブチルエステル(101.5mg、0.29ミリモル) 及びトリフル オロ酢酸(2ml) の混合物を室温下にて3時間撹拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣を塩化メチレン5mlに溶解し、トリエチルアミン(2ml、14.35ミリモル)を加え、中和した。中和液を減圧下にて濃縮し、残渣をメタノール5mlに溶解し、4-フェニルベンズアルデヒド(156mg、0.86ミリモル)、シアノトリヒドロホウ酸ナトリウム(53mg、0.84ミリモル)、20 酢酸(0.05ml、0.87ミリモル)の順に加え 家児下にて※布提料1を
- 20 酢酸(0.05m1、0.87ミリモル)の順に加え、室温下にて終夜撹拌した。 反応液を減圧下にて濃縮し、残渣に飽和重曹水を加え、塩化メチレンにより2回 抽出した。有機相を合わせ、飽和重曹水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸マグネ シウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲ ルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル)により精製し、白色粉末結晶の
- 25 (R) -2-[4-(4-ビフェニリルメチル) ピペラジン-1-イルメチル] -6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (56 mg、収率46%) を得た。

[α] $_{D}^{28}$ = 28.261° (濃度:0.046, DMSO)。 融点 224-225℃ 対応する出発原料を用い、実施例411と同様にして、実施例412の化合物を製造した。

実施例412

(R)-6-ニトロー2-[4-(4-トリフルオロメチルベンジル)ピペラジ 5 ン-1-イルメチル]-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール 収率48%、融点 141-143%

実施例413

15

- (S) -2-メチル-6-ニトロ-2- [4-(4'-トリフルオロメチルビフェニル-4-イルメチル) ピペラジン-1-イルメチル]-2, 3-ジヒドロイ
- 10 ミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造

- 4'ートリフルオロメチルビフェニルー4ーカルボアルデヒド(2.3g、9.19ミリモル)、シアノトリヒドロホウ酸ナトリウム(580mg、9.23ミリモル)、酢酸(0.55ml、9.62ミリモル)の順に加え、室温下にて終夜撹拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣に飽和重曹水を加え、塩化メチレ
- 20 ンにより2回抽出した。有機相を合わせ、飽和重曹水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=50/1)により精製し、白色粉末結晶の(S)-2-メチルー6-ニトロー2-[4-(4'-トリフルオロメチルビフェニルー4-イルメチル)ピペラジンー1-
- 25 イルメチル] -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (1. 4 7g、収率63%) を得た。

 $[\alpha]_D^{28} = 1.831$ °(濃度:0.71, CHCl₃)

- ¹H-NMR (CDCl₃) δppm:
- 1. 60 (3H, s), 2. 20-2. 45 (4H, m), 2. 45-2. 65

(4H, m), 2. 50 (1H, d, J=15.0Hz), 2. 86 (1H, d, J=15.0Hz), 3. 48 (2H, s), 3. 89 (1H, d, J=10.0Hz), 4. 31 (1H, d, J=10.0Hz), 7. 37 (2H, d, J=8.0Hz), 7. 50-7. 56 (3H, m), 7. 68 (4H, s).

5 対応する出発原料を用い、実施例413と同様にして、実施例414~実施例 417の化合物を製造した。

実施例414

- (S) -2-メチル-6-ニトロ-2- [4-(4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン-1-イルメチル] -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b]
- 10 オキサゾール

融点 110-112℃。

実施例 4 1 5

(S) -2-[4-(4-ビフェニリルメチル) ピペラジン<math>-1-イルメチル] -2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダブ [2, 1-b] オキサブ

15 ール

融点 182-184℃。

実施例 4 1 6

- (S) -2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペラジン-1-イルメチル] -2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-
- 20 b] オキサゾール

融点 137-138℃。

実施例417

- 25 3ージヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

融点 174.3-175.5℃。

実施例418

(R) - 2 - [4 - (4 - ビフェニリルメチル) ピペラジン-1 - イルメチル] - 2 - メチル-6 - ニトロー2, 3 - ジヒドロイミダゾ <math>[2, 1 - b] オキサゾ

ールの製造

実施例396で製造した(R)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジ ヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1 -カルボン酸 t e r t ーブチルエステル(100mg、0.27ミリモル)及び トリフルオロ酢酸(2m1)の混合物を室温下にて3時間撹拌した。反応液を減 5 圧下にて濃縮し、残渣を塩化メチレン5mlに溶解し、トリエチルアミン(1 m1、7.17ミリモル)を加え、中和した。中和液を減圧下にて濃縮し、残渣 をメタノール5m1に溶解し、4-フェニルベンズアルデヒド(149mg、0. 82ミリモル)、シアノトリヒドロホウ酸ナトリウム(51mg、0.82ミリ モル)、酢酸(48 µ 1、0.82 ミリモル)の順に加え、室温下にて15時間 10 撹拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣に飽和重曹水を加えることによって 得られる結晶を濾取した。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エ チル) により精製し、微黄色粉末結晶の(R)-2-(4-ビフェニル-4-イ ルメチルピペラジンー1ーイルメチル)ー2ーメチルー6ーニトロー2,3ージ ヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (67mg、収率57%) を得た。 15 融点 112-114℃。

対応する出発原料を用い、実施例418と同様にして、実施例419の化合物 を製造した。

実施例419

20 (R) -2-メチル-6-ニトロ-2- [4-(4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン-1-イルメチル] -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

融点 93-95℃。

実施例420

25 (S) -2-クロロ-1- [4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル] エタノンの製造

実施例393で製造した(S)-4-(2-メチルー6-ニトロー2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールー2ーイルメチル)ピペラジンー1

- 5 氷冷下にてクロロアセチルクロリド(0.49ml、6.2ミリモル)を塩化メ チレン2mlに溶解した溶液を徐々に滴下し、室温下にて終夜撹拌した。反応液 を2回水洗後、飽和重曹水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸マグネシウムにより 乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムク ロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=100/1)により精製し、淡
- 10 茶粉末の(S) -2-クロロー1-[4-(2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル)ピペラジンー1ーイル]エタノン(600mg、収率43%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

- 1. 64 (3H, s), 2. 50-2. 70 (3H, m), 2. 61 (1H, d,
- 15 J=15.0Hz), 2.70-2.90(1H, m), 2.89(1H, d, J=15.0Hz), 3.15-3.55(3H, m), 3.60-3.75(1H, m), 3.97(1H, d, J=10.0Hz), 4.03(2H, s), 4.30(1H, d, J=10.0Hz), 7.55(1H, s)。 実施例421
- 20 (S) -2-(4-クロロフェノキシ) -1-[4-(2-メチル-6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル) ピペラジン-1-イル] エタノンの製造

実施例420で製造した(S)-2-クロロ-1-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチ

25 ル)ピペラジン-1-イル]エタノン(300mg、0.87ミリモル)、4-クロロフェノール(170mg、1.32ミリモル)、炭酸カリウム(180mg、1.3ミリモル)及びDMF(5ml)の混合物を60℃にて3時間撹拌した。反応液を室温に戻し、水を加え、酢酸エチルにより2回抽出した。有機相を合わせ、苛性ソーダ水溶液、水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸マグネシウム

5

10

15

融点 179-180℃。

実施例422

実施例420で製造した(S) -2-クロロ-1-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b] オキサゾールー2ーイルメチ ル)ピペラジン-1ーイル]エタノン(300mg、0.87ミリモル)及び4 ークロロチオフェノール(190mg、1.32ミリモル)を用い、実施例42 1と同様の方法により、白色粉末の(S) -2-(4-クロロフェニルスルファ ニル)-1-[4-(2-メチルー6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b] オキサゾールー2ーイルメチル)ピペラジン-1ーイル]エタノン(80mg、収率20%)を得た。

融点 142-145℃。

20 実施例423

実施例393で製造した(S) -4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジ 25 ヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1 ーカルボン酸tertーブチルエステル(300mg、0.82ミリモル) 及び トリフルオロ酢酸(6ml)の混合物を室温下にて3時間撹拌した。反応液を減 圧下にて濃縮した。残渣を塩化メチレン15mlに溶解し、トリエチルアミン (2ml、14.35ミリモル)を加えた。氷冷下にて4-クロロ塩化ベンゾイ ル (150.7 mg、0.86ミリモル)を加え、室温下にて1時間撹拌した。 反応液を飽和重曹水、水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をジエチルエーテル及び酢酸エチルにより処理し、黄色粉末結晶の(S)ー(4ークロロフェニル)ー[4ー(2ーメチルー6ーニトロー2,3ージヒドロイミダゾ[2,1ーb]オキサゾールー2ーイルメチル)ピペラジンー1ーイル]メタノン(282 mg、収率85%)を得た。

融点 173-174℃。

対応する出発原料を用い、実施例423と同様にして、実施例424の化合物 10 を製造した。

実施例424

 $(4-\forall 7x=)$ ル) - $[4-(2-\forall 7)-6-2-10-2, 3-\forall 10-2-10-2]$ = 5 =

15 融点 116-118℃。

実施例425

[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル] -フェニルメタノンの製造

実施例306で製造した2-(4-tert-ブトキシカルボニルピペラジン-1-イル)メチルー2ーメチルー6ーニトロー2,3ージヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(142mg、0.39ミリモル)、トリフルオロ酢酸(1m1)及び塩化メチレン(1m1)の混合物を室温下にて1時間撹拌した。反応液を減圧下にて濃縮した。残渣を塩化メチレン2m1に溶解し、トリエチルアミン(2m1、14.35ミリモル)を加えた。氷冷下にて塩化ベンゾイル(54μ1、0.46ミリモル)を加え、室温下にて1時間撹拌した。反応液を塩化メチレンにより希釈し、飽和重曹水、水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をジエチルエーテルにより処理し、黄色粉末結晶の「4-(2-メチル-6-ニトロー

2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2-イルメチル) ピペラジンー1-イル] ーフェニルメタノン(72mg、収率50%)を得た。 融点 145-148.7 \mathbb{C}_{\circ}

対応する出発原料を用い、実施例425と同様にして、実施例426〜実施例 5 433の化合物を製造した。

実施例426

10 融点 150.0-155.2℃。

実施例427

[4-(2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オ キサゾールー2ーイルメチル) ピペラジンー<math>1-イル] -(ピリジン-4-イル) メタノン

15 ¹H-NMR (CDCl₃) δ p p m:
1. 62 (3H, s), 2. 25-2. 75 (4H, m), 2. 61 (1H, d, J=14. 9Hz), 2. 88 (1H, d, J=14. 9Hz), 3. 00-3.
93 (4H, br), 3. 95 (1H, d, J=9. 8Hz), 4. 30 (1H, d)

d, J = 9.8 Hz), 7. 26-7.55(2 H, m), 7. 59(1 H, m)

20 s), 8. 67-8. 72(2H, m)

実施例428

1-[4-(2-x+n-6------2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2-イルメチル)ピペラジンー<math>1-イル]-2-フェニルエタノン

25 融点 175.2-175.9℃。

実施例429

融点 166.8-169.1℃。

実施例430

 $1 - [4 - (2 - \cancel{y} + \cancel{y} - 6 - \cancel{z} + \cancel{y} - 2 - 2, 3 - \cancel{y} + \cancel{y} + \cancel{y} + 2 - 2 - 2, 3 - \cancel{y} + \cancel{y} + \cancel{y} + 2 - 2 - 2, 3 - \cancel{y} + \cancel{y$

5 エタノン

融点 158-160.6℃。

実施例431

2-(4-)000フェニル) -1-[4-(2-)3ー ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー 2-4ルメチル) ピペラジンー 3

10 1ーイル] エタノン

融点 184-187℃。

実施例432

(4ービフェニリル) ー [4ー(2ーメチルー6ーニトロー2, 3ージヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル) ピペラジンー1ーイル]

15 メタノン

20

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 63 (3H, s), 2. 45-2. 80 (4H, m), 2. 62 (1H, d, J=14. 9Hz), 2. 90 (1H, d, J=14. 9Hz), 3. 28-3. 81 (4H, br), 3. 95 (1H, d, J=9. 8Hz), 4. 31 (1H, d, J=9. 8Hz), 7. 34-7. 50 (5H, m), 7. 55 (1H,

s), 7.56-7.63(4H, m)。

実施例433

[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オ キサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル] - <math>(4-トリフルオロメ

25 チルフェニル) メタノン

融点 161-162℃。

実施例434

(S) -[4-(2-x+n-6-x+n-2, 3-x+n-6-x+n-2, 3-x+n-6-x+n-2, 3-x+n-1]

ルオロメチルフェニル)メタノンの製造

実施例408で製造した(S) -2-メチルー6-ニトロー2-(ピペラジン-1-イルメチル) -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール・二塩酸塩(2, 36mg、0.882ミリモル) を塩化メチレン10mlに懸濁 し、トリエチルアミン(1ml、7.17ミリモル)を加え、均一溶液とした。この溶液に、氷冷下にて4-(トリフルオロメチル)塩化ベンゾイル(193mg、0.926ミリモル)を加え、室温下にて1時間撹拌した。反応液を飽和重曹水、水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=50/1)により精製し、白色粉末結晶の(S)-[4-(2-メチルー6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b]オキサゾールー2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]-(4-トリフルオロメチルフェニル)メタノン(264mg、収率68%)を得た。

融点 183-184℃。

15 対応する出発原料を用い、実施例434と同様にして、実施例435~実施例438の化合物を製造した。実施例435~437の化合物は、実施例322で製造した2-メチルー6-ニトロ-2-(ピペラジン-1-イルメチル)-2,3-ジヒドロイミダブ[2,1-b]オキサゾール・二塩酸塩から製造した。実施例435

融点 135-137℃。

実施例 4 3 6

25 [4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オ キサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル] - (4-メチルフェニ ル) メタノン

融点 121-122℃。

実施例437

[4-(2-メチル-6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オ キサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル] - (3-トリフルオロメ チルフェニル) メタノン

融点 122-124℃。

5 実施例438

(S) $-2-(40\pi \pi 7 \pi \pi \pi n)$ -1-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル] エタノン

融点 189-190℃。

10 実施例439

(S) -2-(3, 4-ジクロロフェノキシ) -1-[4-(2-メチル-6-1)] -1-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル) ピペラジン-1ーイル] エタノンの製造

3,4-(ジクロロフェノキシ)酢酸(234mg、1.06ミリモル)及び 15 塩化チオニル(5m1)の混合物を30分加熱還流した。反応液を減圧下にて濃 縮し、対応する酸クロリドを得た。

一方、実施例408で製造した(S) -2-メチルー6-ニトロー2-(ピペラジン-1-イルメチル) -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール・二塩酸塩(236mg、0.88ミリモル)を塩化メチレン10m1に懸20 濁し、トリエチルアミン(1m1、7.17ミリモル)を加え、溶液とした。そこへ氷冷下にて、上記の酸クロリドを塩化メチレン5m1に溶解した溶液を徐々に加え、室温下にて1時間撹拌した。反応液を飽和重曹水、水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール25 =50/1)により精製し、白色粉末結晶の(S) -2-(3, 4-ジクロロフェノキシ) -1-[4-(2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b] オキサゾールー2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]エタノン(183mg、収率44%)を得た。

融点 164-166℃。

対応する出発原料を用い、実施例439と同様にして、実施例440の化合物を製造した。

実施例440

(S) -1-[4-(2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2,

5 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル) ピペラジンー1ーイル] ー4ー(4ートリフルオロメチルフェニル) ブタンー1ーオン

融点 145-146℃。

実施例441

15

(S) -3-(4-クロロフェニル) -1-[4-(2-メチル-6-ニトロー10 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル) ピペラジン-1ーイル] プロペノンの製造

4-クロロ桂皮酸(300mg、1.64ミリモル)、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール(HOBT)(240mg、1.77ミリモル)、WSCD(350mg、1.83ミリモル)及び塩化メチレン(10ml)の混合物を室温下にて30分撹拌し、対応する活性エステルを調整した。

一方、実施例408で製造した(S) -2-メチルー6-ニトロー2-(ピペラジン-1-イルメチル) -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール・二塩酸塩(434mg、1.64ミリモル)を塩化メチレン10mlに懸濁し、トリエチルアミン(3.3ml、2,37ミリモル)を加え、溶解させた。20 そこへ氷冷下にて、上記の活性エステルの反応液を加え、室温下にて3時間撹拌した。反応液を飽和重曹水、水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル)により精製し、白色粉末結晶の(S) -3-(4-クロロフェニル) -1-[4-(2-メチルー6-ニトロー2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾールー2-イルメチル)ピペラジン-1ーイル]プロペノン(180mg、収率26%)を得た。

融点 220-222℃。

対応する出発原料を用い、実施例441と同様にして、実施例442~445 の化合物を製造した。 実施例442

- (S) -3-(ρ -1-[4-(2-)
- 5 融点 177-178℃。

実施例443

- 10 融点 146-147℃。

実施例444

- (S) -3-(3, 4-i) -1-[4-(2-i)] -1-[4-(2-i)]
- 15 融点 213-215℃。

実施例 4 4 5

- 20 融点 108-111℃。

実施例446

1-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル] -2-(4-トリル) エタノンの製造

実施例322で製造した2-メチルー6-ニトロー2ー(ピペラジンー1ーイルメチル)ー2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール・二塩酸塩(240mg、0.79ミリモル)をDMF5mlに溶解し、トリエチルアミン(0.22ml、1.58ミリモル)を加え、中和した。続いてこの中和液にpートリル酢酸(140mg、0.93ミリモル)、WSCD(180mg、0.

93ミリモル)の順に加え、室温下にて1時間撹拌した。反応液を酢酸エチルにより希釈し、2回水洗し、続いて飽和重曹水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をエーテルにより処理し、白色粉末の1-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,

5 3 -ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー 2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]-2-(4-トリル)エタノン(172 mg、収率 64%)を得た。

融点 213-214℃。

対応する出発原料を用い、実施例446と同様にして、実施例447の化合物 10 を製造した。

実施例447

(4-i)メチルアミノフェニル) -[4-(2-i)チルー6-iートロー2,3-iジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールー2-iイルメチル)ピペラジンー1-iイル]メタノン

15 融点 204-207℃。

実施例448

- 実施例393で製造した(S)-4-(2-メチル-6-ニトロー2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールー2ーイルメチル)ピペラジンー1ーカルボン酸tertーブチルエステル(300mg、0.82ミリモル)及びトリフルオロ酢酸(10ml)の混合物を室温下にて1時間撹拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣を塩化メチレン10mlに溶解した。この溶液にトリエチルアミン(3ml、21.52ミリモル)を加え、室温下にて10分撹拌後、
 - 3-(4-クロロフェニル)プロパン-1-スルホニルクロリド(300mg、1.19ミリモル)を加え、室温下にて3日間撹拌した。反応液を水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレ

5 融点 150-151℃。

実施例306で製造した2-(4-tert-ブトキシカルボニルピペラジン-1-イルメチル)-2-メチル-6-ニトロ-2, <math>3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールを用い、実施例448と同様にして、実施例449及び実施例450の化合物を製造した。

10 実施例449

2-[4-(4-クロロベンゼンスルホニル) ピペラジン-1-イルメチル] -2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

融点 202-204℃。

15 実施例 4 5 0

融点 215-217℃。

20 実施例451

実施例408で製造した(S) -2-メチル-6-ニトロ-2-(ピペラジン25 -1-イルメチル) -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール・二塩酸塩(236mg、0.88ミリモル)をDMF3mlに溶解し、炭酸カリウム(500mg、3.62ミリモル)、2-(4-クロロフェニル)エタンスルホニルクロリド(240mg、1ミリモル)の順に加え、室温下にて終夜撹拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルにより抽出した。3回水洗後、飽和食塩水

により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=50/1)により精製し、白色粉末結晶の(S)-2-{4-[2-(4-クロロフェニル)エタンスルホニル]ピペラジン-1-イルメチル}-2-メチルー6-ニトロー2、3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(100mg、収率26%)を得た。

融点 192-193℃。

実施例408で製造した(S)-2-メチル-6-ニトロ-2-(ピペラジン-1-イルメチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール・

- 10 二塩酸塩を用い、実施例451と同様にして、実施例452〜実施例454の化合物を製造した。また実施例322で製造した2ーメチルー6ーニトロー2ー (ピペラジンー1ーイルメチル)ー2,3ージヒドロイミダゾ[2,1ーb]オキサゾール・二塩酸塩を用い、実施例451と同様にして、実施例455の化合物を製造した。
- 15 実施例 4 5 2

融点 216-218℃。

- 20 実施例 4 5 3

融点 204-206℃。

- 25 実施例 4 5 4

融点 176-177℃。

実施例455

5 融点 182-184℃。

実施例 4 5 6

- (S) -4-(6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾ ール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸4-トリフルオロメチルベ ンジルエステルの製造
- 10 実施例394で製造した(S)-4-(6-ニトロー2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールー2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル(300mg、0.84ミリモル)を塩化メチレン2 m1に溶解し、トリフルオロ酢酸1m1を加え、室温下にて1時間撹拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣をDMF1m1に溶解し、トリエチルアミン1
- 15 m l を加えて中和した。

一方、4-(トリフルオロメチル) ベンジルアルコール(297 mg、1.69ミリモル)をDMF 1 m l に溶解し、1,1'-カルボニルジイミダゾール(274 mg、1.69ミリモル)を加え、室温下にて1時間撹拌し、活性エステルを調製した。

- 20 この活性エステルの溶液を、先の中和液に加え、室温下にて3時間撹拌した。 反応液に水を加え、酢酸エチルにより2回抽出した。有機相を合わせ、2回水洗 後、飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾 液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メ チレン/メタノール=20/1)により精製し、白色粉末結晶の(S)-4-
- 25 (6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル) ピペラジンー1-カルボン酸4-トリフルオロメチルベンジルエステル (273mg、収率71%) を得た。

[α] $_{D}^{28}$ =-14.851° (濃度:0.404、CHCl₃) 融点 125-125.5℃。 実施例457

- (S) -4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸4-トリフルオロメチルベンジルエステルの製造
- 実施例393で製造した(S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジ 5 ヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル) ピペラジンー1 ーカルボン酸tertーブチルエステル(1.87g、5.09ミリモル)を塩 化メチレン(20m1)に溶解し、トリフルオロ酢酸(20m1)を加え、5分 撹拌した後、減圧下濃縮した。残渣をDMF(20ml)に溶解した。4-(ト リフルオロメチル) ベンジルアルコール (1.92g、10.9ミリモル) のD 10 MF(20m1) 溶液に1, 1'-カルボニルジイミダゾール(1.76g、1)0.9ミリモル)を加え室温で3時間撹拌した混合物を加え、室温で終夜撹拌し た。酢酸エチルで抽出後、有機相を合わせ、水及び飽和食塩水で洗浄した。硫酸 ナトリウムで乾燥後、減圧濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣 をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/アセトン=3/1)に 15 より精製した。イソプロピルアルコールより再結晶し、濾取後減圧乾燥すること により、微黄色粉末結晶の(S)-4-(2-メチルー6-ニトロー2,3-ジ ヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2-イルメチル) ピペラジン-1 ーカルボン酸4-トリフルオロメチルベンジルエステル (1.48g、収率53 20 %)を得た。

融点140.4-141.6℃

光学純度 99.9%ee

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 62 (3H, s), 2. 52-2. 69 (5H, m), 2. 88 (1H, d, J=14. 9Hz), 3. 43 (4H, br), 3. 93 (1H, d, J=9. 7Hz), 4. 28 (1H, d, J=9. 7Hz), 5. 16 (2H, s), 7. 44 (2H, d, J=8. 1Hz), 7. 53 (1H, s), 7. 61 (2H, d, J=8. 1Hz).

実施例458

- (S) -4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2ーイルメチル)ピペラジン-<math>1-カルボン酸1, 3, 3-トリメチル-2-オキソ-2, 3-ジヒドロ-1H-インドール-5-イルメチルエステルの製造
- (S) -4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1 5 -b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸3,3-ジ メチルー2ーオキソー2、3ージヒドロー1H-インドールー5ーイルメチルエ ステル (300mg、0.62ミリモル) 及びDMF (3m1) の混合物に、氷 冷下にて水素化ナトリウム(27mg、0.68ミリモル)を加え、同温度下に て30分撹拌した。続いてこの混合物にヨウ化メチル(97mg、0.68ミリ 10 モル)を加え、室温下にて2時間撹拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルによ り2回抽出した。有機相を合わせ、2回水洗後、飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナト リウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシ リカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル)により精製し、微黄色粉末の (S) -4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-15 b] オキサゾールー2ーイルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸1,3,3-トリメチルー2ーオキソー2、3ージヒドロー1H-インドールー5ーイルメチ ルエステル(140mg、45%)を得た。

融点 80-100℃(分解)。

20 対応する出発原料を用い、実施例458と同様にして、実施例459の化合物 を製造した。

実施例 4 5 9

(S) -4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸<math>1-メチル-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-6-イルメチルエステル融点 <math>189-190℃。

実施例460

25

(S) -4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸3, <math>5-ジク

ロロベンジルエステルの製造

実施例408で製造した(S)-2-メチル-6-ニトロー2-(ピペラジン -1-イルメチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールニ 塩酸塩(300mg、0.88ミリモル)及びDMF(3ml)の混合物にトリ エチルアミン(270mg、2.67ミリモル)を加え中和した。3,5ージク 5 ロロベンジルアルコール(1 8 0 m g 、1. 0 2 ミリモル)をDMF(3 m l) に溶解し、1,1'-カルボニルジイミダゾール(180mg、1.11ミリモ ル)を加え室温下にて2時間撹拌して調製した活性エステルの溶液を、上記中和 液に加え、室温下にて終夜撹拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルで2回抽出 した。有機相を合わせ、2回水洗、飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムにより 10 乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムク ロマトグラフィー(酢酸エチル)により精製し、白色粉末結晶の(S)-4-(2-メチル−6-ニトロ−2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾ ールー2-イルメチル)ピペラジンー1-カルボン酸3,5-ジクロロベンジル 15 エステル(220mg、収率53%)を得た。

融点 129-130℃。

実施例461

(S) -4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸3-(3-ト20 リフルオロメチルフェニル) -2-プロペニルエステル・マレイン酸塩の製造実施例393で製造した(S) -4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1ーカルボン酸tertーブチルエステル(1.09g、2.97ミリモル)を用い、実施例344の方法により、白色粉末の(S) -4-(2-メチル-6-ニシトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸3-(3-トリフルオロメチルフェニル) -2ープロペニルエステル・マレイン酸塩(945mg、63%)を得た。融点 136-138℃。

対応する出発原料を用い、実施例461と同様にして、実施例462〜実施例

465の化合物を製造した。

実施例462

(S) -4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸 [(E) -3-メチル-3-(3-トリフルオロメチルフェニル)]-2-プロペニルエステル・マレイン酸塩

融点 142-143℃。

実施例463

(S) -4-(2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-10 b] オキサゾールー2ーイルメチル) ピペラジンー1ーカルボン酸3-(3-クロロフェニル) -2-プロペニルエステル・マレイン酸塩

融点 150-151℃。

実施例464

(S) -4-(2-メチル-6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-15 b] オキサゾールー2ーイルメチル) ピペラジンー1ーカルボン酸3-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル) -2-プロペニルエステル・マレイン酸塩融点 158-159℃。

実施例465

(S) -4-(2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-20 b] オキサゾールー2ーイルメチル) ピペラジンー1ーカルボン酸 [(Z) -3 ーメチルー3-(3-トリフルオロメチルフェニル)] -2-プロペニルエステル・マレイン酸塩

融点 124-125℃。

実施例466

25 (R) -4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸4-フルオロベンジルエステルの製造

実施例396で製造した(R) -4-(2-メチル-6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル) ピペラジンー1

ーカルボン酸tertーブチルエステル(106mg、0.29ミリモル)を用い、実施例457の方法により、白色粉末の(R)ー4ー(2ーメチルー6ーニトロー2,3ージヒドロイミダゾ[2,1ーb]オキサゾールー2ーイルメチル)ピペラジンー1ーカルボン酸4ーフルオロベンジルエステル(79mg、収5 率66%)を得た。

[α]_D²⁸=19.70° (濃度:1.066, CHCl₃) 融点 167-169℃。

実施例467

(S) -4-(2-メチル-6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-10 b] オキサゾールー2ーイルメチル) ピペラジンー1ーカルボン酸 [3-(4-トリフルオロメチルフェニル) -2-プロペニル] アミドの製造

3-(4-トリフルオロメチルフェニル) -2-プロペニルアミン(761 mg、3.78ミリモル)、1,1'-カルボニルジイミダゾール(613mg、3.78ミリモル)及びDMF(3ml)の混合物を室温下にて終夜撹拌し、反
 15 応液とした。

一方、実施例393で製造した(S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジ ンー1-カルボン酸tert-ブチルエステル(926mg、2.52ミリモ ル)、トリフルオロ酢酸(10ml)及び塩化メチレン(3ml)の混合物を室 温下にて5時間撹拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣をDMF3mlに溶 20 解し、トリエチルアミン(2ml、14.35ミリモル)を加えた。これに上記 の反応液を加え、室温下にて終夜撹拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルによ り抽出した。3回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾 燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラム クロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=20/1)により精製し、微 25 黄色粉末の(S)ー4ー(2ーメチルー6―ニトロー2,3―ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸 [3-(4-)リフルオロメチルフェニル) -2-プロペニル] アミド(1.2) g、収率96%)を得た。

融点 105-107℃。

実施例306で製造した2-(4-tert-ブトキシカルボニルピペラジン-1-イル)メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールを用い、実施例467と同様にして、実施例468~470の化合物を製造した。

実施例 4 6 8

5

4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸(4-トリフルオロメチルベンジル) アミド

10 融点 201-202.5℃。

実施例 4 6 9

4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸(4-トリフルオロメチルフェニル) アミド

15 融点 216-217℃。

実施例470

4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキ サゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸 (4-クロロ-3-ト リフルオロメチルフェニル) アミド

20 融点 222-224℃。

実施例471

- (S) -4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸シクロヘキシルアミドの製造
- 25 実施例408で製造した(S) -2-メチル-6-ニトロー2-(ピペラジンー1ーイルメチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール・二塩酸塩(236mg、0.88ミリモル)を塩化メチレン15m1に懸濁し、トリエチルアミン(2ml、14.35ミリモル)を加えて均一化させた。これにシクロヘキシルイソシアネート(120mg、0.96ミリモル)を加え、室

温下にて1時間撹拌した。反応液を水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=20/1)により精製し、微黄色粉末の(S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2、3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1ーカルボン酸シクロヘキシルアミド(164mg、47%)を得た。

融点 98-101℃。

5

実施例322で製造した2-メチル-6-ニトロ-2-(ピペラジン-1-イルメチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール・二塩酸塩を用い、実施例471と同様にして、実施例472~476の化合物を製造した。 実施例472

4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸(4-メトキシフェニル)アミド

15 融点 167-168℃。

実施例473

4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン<math>-1-カルボン酸 (4-クロロフェニル) アミド

20 融点 185-188℃(分解)。

実施例474

4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸(3-トリフルオロメチルフェニル)アミド

25 融点 183-184℃。

実施例 4 7 5

4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸(3, 4-ジクロロフェニル)アミド

融点 212-214℃(分解)。

実施例476

4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸 (4-メチルフェニ

5 ル) アミド

融点 202-203℃(分解)。

実施例477

(S) -4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸 (4-トリフ

10 ルオロメチルフェニル) アミドの製造

4-アミノベンゾトリフルオリド(<math>142mg、0.882ミリモル)、1, 1'-カルボニルジイミダゾール(<math>143mg、0.882ミリモル)及びDMF(6m1)の混合物を室温下にて終夜撹拌し、反応液とした。

一方、実施例408で製造した(S) -2-メチルー6-ニトロ-2-(ピペ15 ラジン-1ーイルメチル) -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール二塩酸塩(236mg、0.88ミリモル)を塩化メチレン5m1に懸濁し、トリエチルアミン(2ml、14.35ミリモル)を加えて均一化させた。これに上記のDMFの反応液を加え、室温下にて6時間撹拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルにより抽出した。3回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=30/1)により精製し、白色粉末結晶の(S) -4-(2-メチルー6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル)ピペラジンー1ーカルボン酸(4-トリフルオロメチルフェニル)アミド(90mg、収率23%)を得た。

融点 150-152.5℃。

対応する出発原料を用い、実施例477と同様にして、実施例478~実施例481の化合物を製造した。

実施例478

(S) -4-(2-メチル-6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル)ピペラジンー<math>1-カルボン酸(4-メトキシフェニル)アミド

融点 185.5-187.5℃。

- 5 実施例479
 - (S) -4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b] オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸(4-トリフルオロメチルベンジル)アミド

融点 101-103.6℃。

- 10 実施例480
 - (S) -4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-<math>1-カルボン酸(4-クロロフェニル)アミド

融点 156-159℃(分解)。

- 15 実施例 481
 - (S) -4-(2-メチル-6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル)ピペラジンー<math>1-カルボン酸(4-メチルフェニル)アミド

融点 207-210℃(分解)。

- 20 実施例482
 - (S) -4-(2-メチル-6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル)ピペラジンー<math>1-カルボン酸N-メチルー N-(4-トリフルオロメチルフェニル)アミドの製造

実施例477で製造した(S) -4-(2-メチル-6-ニトロ-2、3-ジ 25 ヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1 ーカルボン酸(4-トリフルオロメチルフェニル) アミド(200mg、0.4 4ミリモル)をDMF4mlに溶解し、水素化ナトリウム(26mg、0.66 ミリモル)を加え、室温下にて1.5時間撹拌後、ヨウ化メチル(0.5ml、 0.76ミリモル)を加え、室温下にて終夜撹拌した。反応液に水を加え、酢酸 エチルにより抽出した。3回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=50/1)により精製し、白色粉末結晶の(S)-4-(2-メチルー6-ニトロ-2、3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールー2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸N-メチルーN-(4-トリフルオロメチルフェニル)アミド(35mg、収率17%)を得た。

融点 100.4-102.4℃。

実施例483

(S) - [4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル] - [4-(4-トリフルオロメチルフェニル) ピペリジン-1-イル] メタノンの製造 実施例393で製造した(S) -4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1

- 15 ーカルボン酸 t e r t ーブチルエステル (1. 17g、3. 32ミリモル)、トリフルオロ酢酸 (5 m l) 及び塩化メチレン (10 m l) の混合物を室温下にて2時間撹拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣を塩化メチレン10 m l に溶解し、トリエチルアミン (5 m l、35. 87ミリモル)を加え、室温下にて10分撹拌した。減圧下にて濃縮し、残渣をDMF15 m l に溶解し、炭酸カリウ
- 20 ム(920mg、6.64ミリモル)を加え、氷冷下にて4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペリジン-1-カルボニルクロリド(1.07g、3.65ミリモル)をDMF10mlに溶解した溶液を徐々に滴下した。室温下にて終夜撹拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルにより抽出した。3回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧
- 25 下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=30/1)により精製し、白色粉末結晶の(S)-[4-(2-メチルー6-ニトロー2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールー2ーイルメチル)ピペラジン-1-イル]-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペリジン-1-イル]メタノン(575mg、収率33%)を得た。

融点 179.1-181.9℃。

実施例484

(S) - [4-(4-クロロフェニル) -1, 2, 3, 6ーテトラヒドロピリジン-1ーイル] - [4-(2-メチルー6ーニトロー2, 3ージヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル) ピペラジン-1ーイル] メタノンの製造

実施例408で製造した(S) -2-メチルー6-ニトロー2-(ピペラジン
-1-イルメチル) -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールニ
塩酸塩(401mg、1.5ミリモル)をDMF8mlに溶解し、炭酸カリウム
(750mg、5.4ミリモル)を加え、室温下にて10分撹拌後、氷冷下にて
4-(4-クロロフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジンー1-カ
ルボニルクロリド(400mg、1.56ミリモル)をDMF3mlに溶解した
溶液を徐々に滴下した。室温下にて終夜撹拌した。反応液に水を加え、酢酸エチ
ルにより抽出した。3回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムによ
り乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をエタノールか
ら再結晶し、微黄色粉末結晶の(S)-[4-(4-クロロフェニル)-1, 2,
3,6-テトラヒドロピリジン-1-イル]-[4-(2-メチルー6-ニトロ
-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールー2ーイルメチル)ピ
ペラジン-1-イル]メタノン(380mg、収率53%)を得た。

20 融点 161-162℃。

実施例 408で製造した(S) -2-メチル-6-ニトロ-2-(ピペラジン -1-イルメチル) -2、3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール・二塩酸塩を用い、実施例 484 と同様にして、実施例 485 及び実施例 486 の 化合物を製造した。また実施例 322 で製造した 2-メチル-6-ニトロ-2-(ピペラジン-1-イルメチル) -2、3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール・二塩酸塩を用い、実施例 484 と同様にして、実施例 487 の化合物を製造した。

実施例485

25

(S) -[4-(4-クロロフェニル) ピペリジン<math>-1-イル] -[4-(2-

メチルー6ーニトロー2, 3ージヒドロイミダゾ [2, 1ーb] オキサゾールー2ーイルメチル) ピペラジンー1ーイル] メタノン

融点 156-159℃。

実施例486

5 (S) - [4-(2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル) ピペラジンー1ーイル] - [4-(4-トリフルオロメチルフェニル) -1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1ーイル] メタノン

融点 168.4-171.7℃。

10 実施例487

融点 186-187℃。

- 15 実施例488
 - (S) -4-[4-(2-メチル-6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル) ピペラジンー<math>1-4ル] 安息香酸の製造
 - (S) -4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ
- 20 [2,1-b] オキサゾールー2ーイルメチル)ピペラジンー1ーイル] 安息香酸 tertーブチルエステル (300mg、0.68ミリモル)をトリフルオロ酢酸10ml中室温にて5時間撹拌した。反応液を減圧下濃縮し、トリエチルアミンで中和した。これを減圧下濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=20/1)により精製し、メタノールージイソプロピルエーテルより結晶化を行い、白色粉末の(S)ー4ー[4ー(2ーメチルー6ーニトロー2,3ージヒドロイミダゾ[2,1ーb] オキサゾールー2ーイルメチル)ピペラジンー1ーイル] 安息香酸 (186mg、収率71%)を得た。

 $MS 387 (M^{+})$

融点 248-252℃。

実施例489

(S) -2-[4-(2,6-ジフェニルピリミジン<math>-4-イル) ピペラジン-1-イルメチル] -2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2,

5 1-b] オキサゾールの製造

- 10 拌した。反応液を減圧下濃縮し、塩化メチレン及びトリエチルアミンを4mlずつ加えた。反応液を室温で5分撹拌した後、減圧下濃縮した。残渣をDMF5mlに溶解し、4-クロロ-2,6-ジフェニルピリミジン(400mg、1.50ミリモル)、DBU(0.2ml、1.36mミリモル)を加え、100℃で5時間撹拌した。反応液を室温に戻し、水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。飽
- 15 和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=100/1)により精製し、塩化メチレンージイソプロピルエーテルより結晶化を行い、白色粉末の(S)-2-[4-(2,6-ジフェニルピリミジン-4-イル)ピペラジン-1-イルメチル]-2-メチルー6-ニト
- 20 ロー2, 3ージヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール(113mg、収率 17%)を得た。

MS 498 (M+H) +

融点 202.5-205.4℃。

対応する出発原料を用い、実施例489と同様にして、実施例490の化合物 25 を製造した。

実施例490

収率7%、融点 201.2-205.4℃。

実施例491

{4-[3-(2-クロロー4-ニトロイミダゾールー1-イル)-2-ヒドロキシー2-メチルプロピル] ピペラジンー1-イル} カルバミン酸 tertーブチルエステルの製造

15 プロピル] ピペラジン-1-イル} カルバミン酸tertーブチルエステル(1.55g、収率32%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 12 (3H, s), 1. 46 (9H, s), 2. 36 (1H, d, J=13. 9Hz), 2. 50 (1H, d, J=13. 9Hz), 2. 64-2. 84 (8H, m), 3. 32 (1H, s), 3. 96 (2H, s), 5. 46 (1H, br), 8. 03 (1H, s).

実施例492

20

25

 ${4-[3-(2-\rho uu-4--1)u+1-4) - 2-e}$ ドロ キシー 2-yチルプロピル] ピペラジンー1-4ル} カルバミン酸 tert tert チルエステルの製造(実施例 491 の化合物の別途合成法)

実施例493

5 [4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オ キサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル] カルバミン酸 tert で ブチルエステルの製造

実施例492で製造した {4-[3-(2-クロロー4ーニトロイミダゾール-1-イル) -2-ヒドロキシー2-メチルプロピル] ピペラジンー1ーイル}

- 10 カルバミン酸 tertーブチルエステル (6.87g、16.4ミリモル)を用い、実施例393と同様の方法により、白色粉末結晶の [4-(2-メチル-6-1-1-1-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾールー2ーイルメチル) ピペラジン-1-イル] カルバミン酸 tertーブチルエステル (2.71g、収率43%)を得た。

20 実施例494

[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オ キサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル] カルバミン酸ベンジルエ ステルの製造

実施例493で製造した [4-(2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロ 25 イミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル) ピペラジンー1ーイル] カルバミン酸 tertーブチルエステル (150mg、0.39ミリモル) 及びトリフルオロ酢酸 (4ml) の混合物を室温下にて3時間撹拌した。反応液を減圧下にて濃縮した。残渣を塩化メチレン4mlに溶解し、トリエチルアミン(4ml、28.7ミリモル)を加え、中和した。次いでこれに、氷冷下にてク

ロロギ酸ベンジル(100mg、0.59ミリモル)を加え、室温下にて2時間 撹拌した。反応液に飽和重曹水を加え、塩化メチレンにより抽出した。水洗後、 飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾 液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(nーへ キサン/アセトン=1/1)により精製し、微黄色粉末結晶の [4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]カルバミン酸ベンジルエステル(6.5 mg、収率4%)を得た。

 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

10 1.60 (3H, s), 2.53-2.90 (10H, m), 3.89 (1H, d, J=9.6Hz), 4.27 (1H, d, J=9.6Hz), 5.11 (2H, s), 5.88 (1H, br), 7.25-7.34 (5H, m), 7.5 2 (1H, s).

実施例495

N-[4-(2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル) ピペラジンー1ーイル] -N-(4-トリフルオロメトキシベンジリデン) アミン) の製造

実施例493で製造した [4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イ

- 20 ル] カルバミン酸 t e r t ーブチルエステル (40 m g、0.11ミリモル)、4ートリフルオロメトキシベンズアルデヒド (24 m g、0.13ミリモル)、トリフルオロ酢酸 0.08 m l 及び塩化メチレン (1 m l) の混合物を室温下にて3時間撹拌した。飽和重曹水を加えて中和し、塩化メチレンにより抽出した。水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、減圧濾過
- 25 した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル= 3/1) により精製し、白色粉末結晶のN-[4-(2-x+)-6-x+] (2-x+) ピペラジン-1-x+) パールー 2-x+ (2-x+) ピペラジン-1-x+ (2-x+) アミン (19x+) を得た。

融点 189.2-190.9℃。

実施例496

5 1ーイル}プロパンー2ーオールの製造

実施例12で製造した (R) -2-クロロ-1- (2-メチル-2-オキシラニルメチル) -4-ニトロイミダゾール (218 mg、1ミリモル) 、N-(ピペラジン-1-イル)-N- (4-トリフルオロメチルベンジリデン) アミン (283 mg、1.1ミリモル) 及びDMF (2 m1) の混合物を70-80 $^{\circ}$

10 にて7時間撹拌した。反応液を室温に戻し、水を加え、酢酸エチルにより2回抽出した。有機相を合わせ、3回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(nーヘキサン/アセトン=1/1)により精製し、微黄色粉末結晶の(S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1

15 ーイル) -2-メチル-3- {4-[(4-トリフルオロメチルベンジリデン)アミノ] ピペラジン-1-イル} プロパン-2-オール (402mg、収率85%) を得た。

 $[\alpha]_D^{27} = 19.01^{\circ}$ (濃度: 1.010, CHCl₃) ^1H-NMR (CDCl₃) δ p p m:

20 1. 18 (3H, s), 2. 42 (1H, d, J=13. 9Hz), 2. 57 (1H, d, J=13. 9Hz), 2. 71-2. 95 (4H, m), 3. 10 -3. 33 (5H, m), 4. 02 (2H, s), 7. 51 (1H, s), 7. 58 (2H, d, J=8. 4Hz), 7. 68 (2H, d, J=8. 4Hz), 8. 05 (1H, s).

25 実施例497

実施例12で製造した(R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラ

5 ロキシー2ーメチルプロピル]ピペラジンー1ーイル}カルバミン酸tertーブチルエステル(36.68g、収率64%)を得た。

[α] D^{27} =17.793° (濃度:1.006, CHCl₃) 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1. 12 (3H, s), 1. 45 (9H, s), 2. 36 (1H, d, J=14.

10 0 H z), 2. 50 (1 H, d, J=14.0Hz), 2. 64-2.84 (8 H, m), 3. 32 (1 H, s), 3. 97 (2 H, s), 5. 47 (1 H, br), 8. 04 (1 H, s)

対応する出発原料を用い、実施例497と同様にして、実施例498~実施例500の化合物を製造した。

15 実施例498

 $[\alpha]_D^{27} = 12.326^{\circ}$ (濃度: 1.006, CHCl₃)

20 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1. 17 (3H, s), 2. 41 (1H, d, J=13.9Hz), 2. 56 (1H, d, J=13.9Hz), 2. 71-2. 95 (4H, m), 3. 14 -3. 29 (5H, m), 4. 01 (2H, s), 7. 19 (2H, d, J=8.0Hz), 7. 50 (1H, s), 7. 62 (2H, d, J=8.0Hz), 8.

25 05 (1H, s).

実施例499

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 18 (3H, s), 2. 43 (1H, d, J=14. 0Hz), 2. 58 (1H, d, J=14. 0Hz), 2. 73-2. 82 (2H, m), 2. 86 -2. 95 (2H, m), 3. 17 (1H, s), 3. 31 (4H, s), 4.

5 03 (2H, s), 6. 82 (1H, s), 7. 46 (1H, s), 7. 52 (1H, d, J=8. 7Hz), 7. 59 (1H, d, J=8. 7Hz), 7. 83 (1H, s), 8. 05 (1H, s).

実施例500

(S) -1- {4- [(5-クロロベンゾフラン-2-イルメチレン) アミノ]

10 ピペラジン-1 - イル $\}$ - 3 - (2 - クロロー4 - ニトロイミダゾール-1 - イル) - 2 - メチルプロパン-2 - オール

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 18 (3H, s), 2. 42 (1H, d, J=14.0Hz), 2. 57 (1H, d, J=14.0Hz), 2. 71-3. 00 (4H, m), 3. 17

15 (1H, s), 3. 23-3. 38 (4H, m), 4. 02 (2H, s), 6.
71 (1H, s), 7. 22 (1H, dd, J=2. 1Hz, 8. 7Hz), 7.
33-7. 43 (2H, m), 7. 50 (1H, d, J=2. 1Hz), 8. 0
5 (1H, s).

実施例501

実施例12で製造した(R) -2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラ -ルメチル) -4-ニトロイミダゾール(0.610g、2.82ミリモル)及 びピペラジン-1-イル-(4-トリフルオロメチルフェニル)アミン(0.760g、3.09ミリモル)を用い、実施例496と同様の方法により、無色固体の(S) -1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-3-[4-(4-トリフルオロメチルフェニルアミノ)ピペラジン-1-イル]プロパン-2-3-3-1、125g、収率86%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 15 (3H, s), 2. 39 (1H, d, J=14.0Hz), 2. 54 (1H, d, J=14.0Hz), 2. 60-2. 95 (8H, m), 3. 25 (1H, s), 3. 99 (2H, s), 4. 67 (1H, s), 6. 90 (2H, d, J=8.6Hz), 7. 43 (2H, d, J=8.6Hz), 8. 04 (1

5 d, J=8.6Hz), 7.43 (2H, d, J=8.6Hz), 8.04 (1 H, s).

実施例502

(S) -N-[4-(2-メチル-6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル) ピペラジンー<math>1-4ル] -4-トリフ

10 ルオロメチルアニリンの製造

実施例 501 で製造した(S) -1-(2-0) ロロー 4-1 トロイミダゾール -1-1 ル) -2-1 チルー 3-1 [4-(4-1) リールオロメチルフェニルアミ ノ) ピペラジン -1-1 ル] プロパン -2-1 ール(1.125g、2.435 リモル)を用い、実施例 493 と同様の方法により、白色固体の(S) -1 ー

15 [4-(2-メチル-6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル) ピペラジン-1ーイル] ー4ートリフルオロメチルアニリン(0.715g、収率69%)を得た。

融点 192.1-195.3℃。

実施例503

20 (S) -[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン<math>-1-イル] カルバミン酸 tert-ブチルエステルの製造

実施例 497で製造した(S) $-\{4-[3-(2-2)-4-2]$ で製造した(S) $-\{4-[3-(2-2)-4-2]$ がゾールー 1-4 ル) -2-2 ドロキシー 2-3 チルプロピル] ピペラジンー 1

25 ーイル カルバミン酸 t e r t ーブチルエステル (36.68g) を用い、実施 例493と同様の方法により、白色粉末結晶の (S) ー [4-(2-メチル-6-1-1-1-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメ チル) ピペラジンー1ーイル] カルバミン酸 t e r t ーブチルエステル (19.51g、収率58%) を得た。

光学純度 >99.5%ee

 $[\alpha]_{D}^{27} = 9.84^{\circ}$ (濃度: 1.016, CHCl₃)

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 43 (9H, s), 1. 60 (3H, s), 2. 35 (1H, d, J=14.

5 0Hz), 2. 52-2. 92 (9H, m), 3. 89 (1H, d, J=9. 7 Hz), 4. 27 (1H, d, J=9. 7Hz), 5. 35 (1H, s), 7. 53 (1H, s).

実施例504

(S) -N-[4-(2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ[2,

10 1-b] オキサゾールー2-イルメチル)ピペラジン-1-イル] -N-(4-トリフルオロメチルベンジリデン)アミンの製造

実施例496で製造した(S) $-1-(2-\rho - 4-1)$ に 実施例496で製造した(S) $-1-(2-\rho - 4-1)$ に $-1-(4-\rho - 4-1)$ に

15 85ミリモル)及びDMF (4ml) の混合物に氷冷下にて水素化ナトリウム (69mg、1.73ミリモル)を加え、同温度下にて2.5時間撹拌した。反 応液に水を加え、析出する結晶を濾取した。これをメタノールにより洗浄後、アセトン/水から再結晶することにより、微黄色粉末結晶の(S)-N-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾ

20 ールー2ーイルメチル) ピペラジンー1ーイル] -Nー(4ートリフルオロメチルベンジリデン)アミン(248mg、収率69%)を得た。

融点201-202.3℃(分解)

光学純度 >99.5%ee

 $[\alpha]_{D}^{27} = -64.64^{\circ}$ (濃度: 1.018, CHCl₃)

 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1. 64 (3H, s), 2. 55-2. 79 (3H, m), 2. 80-3. 20 (7H, m), 3. 94 (1H, d, J=9. 7Hz), 4. 33 (1H, d, J=9. 7Hz), 7. 44 (1H, s), 7. 48-7. 67 (5H, m)。 対応する出発原料を用い、実施例504と同様の方法により、実施例505~

実施例507の化合物を製造した。

実施例505

(S) -N-[4-(2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル) ピペラジン<math>-1-イル] -N-(4-

5 トリフルオロメトキシベンジリデン) アミン

融点188.4-191.2℃

光学純度 >99.0%ee

 $[\alpha]_{D}^{27} = -58.30^{\circ}$ (濃度: 1.024, CHCl₃)

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

- 10 1.64 (3H, s), 2.55-2.77 (3H, m), 2.82-3.18 (7H, m), 3.94 (1H, d, J=9.7Hz), 4.33 (1H, d, J=9.7Hz), 7.16 (2H, d, J=8.2Hz), 7.43 (1H, s), 7.55 (1H, s), 7.58 (2H, d, J=8.2Hz)。 実施例506
- 15 (S) -N-[4-(2-メチル-6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル)ピペラジンー<math>1-4ル] -N-(5-1)トリフルオロメチルベンゾフランー2-4ルメチレン)アミン

融点 190.2-191.8℃

光学純度 99.8%ee

20 $\left[\alpha\right]_{D}^{27} = -81.05^{\circ} \text{ (c=0.992, CHCl}_{3})$ $^{1}\text{H-NMR (CDCl}_{3}) \delta \text{ppm}:$

1. 64 (3H, s), 2. 59-2. 77 (3H, m), 2. 86-3. 00 (3H, m), 3. 05-3. 26 (4H, m), 3. 96 (1H, d, J=9.

7 Hz), 4. 33 (1H, d, J=9. 7 Hz), 6. 79 (1H, s), 7.

- 25 39 (1H, s), 7. 41-7. 57 (3H, m), 7. 82 (1H, s)。 実施例507

光学純度 > 99.0%ee

 $[\alpha]_{D}^{27} = -84.48^{\circ}$ (濃度: 1.018, CHCl₃)

融点 213.8-215.7℃

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

- 5 1. 63 (3H, s), 2. 57-2. 76 (3H, m), 2. 81-2. 95 (3H, m), 3. 00-3. 24 (4H, m), 3. 94 (1H, d, J=9. 7Hz), 4. 32 (1H, d, J=9. 7Hz), 6. 67 (1H, s), 7. 17-7. 23 (1H, m), 7. 30-7. 43 (2H, m), 7. 48 (1H, d, J=2. 1Hz), 7. 53 (s, 1H).
- 10 実施例508
- 実施例503で製造した(S)-[4-(2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル) ピペラジンー1ーイル] カルバミン酸tertーブチルエステル(0.20g、0.523ミリモル)及び5-クロロベンゾフランー2ーカルボアルデヒド(0.113g、0.628ミリモル)を塩化メチレン4mlに溶解し、トリフルオロ酢酸0.4
- 20 mlを加え、室温で2時間撹拌した。反応液に飽和炭酸水素ナトリウム水を加え、塩化メチレンで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=4/1)により精製した。微黄色粉末結晶の(S)-N-(5-クロロベンゾフラン-2-イル
- 25 メチレン) -N- [4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル] アミン (0.137g、収率59%) 得た。

実施例509

(S) -N-[1-(4-クロロフェニル) エチリデン] -N-[4-(2-メ

チルー6ーニトロー2, 3ージヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2 ーイルメチル) ピペラジンー1ーイル] アミンの製造

実施例503で製造した(S) - [4-(2-メチルー6-ニトロー2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b] オキサゾールー2ーイルメチル) ピペラジンー5 1ーイル] カルバミン酸 tertーブチルエステル(200mg、0.52ミリモル)、トリフルオロ酢酸2ml及び塩化メチレン(4ml)の混合物を室温下にて30分撹拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣を塩化メチレン4mlに溶解し、トリエチルアミン(4ml、28.7ミリモル)を加え、中和した。中和液に4-クロロアセトフェノン(97mg、0.63ミリモル)をエタノール10 4mlに溶解した溶液を加え、4時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(nーヘキサン/アセトン=3/1)により精製した。微黄色粉末結晶の(S)-N-[1-(4ークロロフェニル)エチリデン]-N-[4-(2ーメチルー6ーニトロー2,3ージヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールー2ーイルメチル)ピペラジ15 ンー1ーイル]アミン(39mg、収率18%)を得た。

融点 164.6-166.5℃。

対応する出発原料を用い、実施例509と同様にして、実施例510~実施例513の化合物を製造した。

実施例510

20 (S) -N-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン<math>-1-イル] -N-[1-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチリデン] アミン

融点 167.9-169.4℃。

実施例511

融点 177.8-180.1℃。

実施例512

(S) $-N-\nu$ クロヘキシリデン $-N-[4-(2-\lambda + \nu - 6-\nu - 2, 3-\nu + \nu - 6-\nu - 2, 1-\nu - 2-\nu - 2, 1-\nu - 2-\nu - 2, 1-\nu - 2-\nu -$

融点 178.6-179.3℃。

5 実施例513

N-(2-ベンジリデンへプチリデン)-N-[4-(2-メチル-6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル] アミン

融点 166.6-169.6℃。

- 10 実施例514
 - (S) -N-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン<math>-1-イル]-N-(4-トリフルオロメチルベンジル)アミンの製造

実施例504で製造した(S)-N-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,

- 15 3ージヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル) ピペラジンー1ーイル] -Nー(4ートリフルオロメチルベンジリデン) アミン(100mg、0.23ミリモル) 及びTHF(4ml) の混合物に、氷冷下にて水素化ホウ素ナトリウム(13mg、0.34ミリモル) を加え、室温下にて30分撹拌した。反応液にメタノール1mlを加え、減圧下にて濃縮した。残渣をシリカ
- 20 ゲルカラムクロマトグラフィー(nーヘキサン/酢酸エチル=2/1)により精製し、微黄色粉末結晶の(S)-N-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]-N-(4-トリフルオロメチルベンジル)アミン(32mg、収率31%)を得た。
- 25 融点 131.3-135.5℃。

実施例515

(S) -4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イルアミン・二塩酸塩の製造

実施例 503で製造した(S) -[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾールー2ーイルメチル)ピペラジンー1-イル] カルバミン酸 t e r t - ブチルエステル(300 m g、0.78 ミリモル)、濃塩酸 2 m 1 及びメタノール(4 m 1)の混合物を50 $^{\circ}$ にて 30 分撹 拌した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣をメタノール/エーテルから再結晶し、黄色粉末結晶の(S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2、3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イルアミン二塩酸塩(265 m g、収率 91 %)を得た。融点 176 $^{\circ}$ (分解)。

10 実施例516

 $3-[3-(2-\rho \Box \Box -4-\Box +\Box +2)$ $-2-\Box + \Box +2-\Box +2$ $-2-\Box +2$ -2

2-クロロー4-ニトロー1H-イミダゾール (2. 21g、14. 98ミリ モル) と3- (2-メチルー2-オキシラニルメチル) -5- (4-トリフルオ ロメトキシフェニル) -3H- [1, 3, 4] オキサジアゾールー2-オン (2. 37g、7. 49ミリモル) のエタノール (25ml) 懸濁液に炭酸水素ナトリ ウム (1. 32g, 15. 73ミリモル) を加え、8時間加熱還流した。反応液 に水を加え、塩化メチレンで抽出し、硫酸マグネシムで乾燥後、減圧濃縮し、微 20 黄色アモルファスの3- [3- (2-クロロー4-ニトロイミダゾールー1ーイ ル) -2-ヒドロキシー2-メチルプロピル] -5- (4-トリフルオロメトキ シフェニル) -3H- [1, 3, 4] オキサジアゾールー2-オン (3. 27g、 収率94%) を得た。

 $^{1}H-NMR$ (DMSO-d₆) δ ppm:

25 1. 53 (3H, s), 3. 67 (1H, d, J=8. 8Hz), 3. 81 (1 H, d, J=8. 8Hz), 4. 49 (2H, s), 7. 42-7. 66 (2H, m), 7. 86-8. 09 (2H, m), 8. 54 (1H, s), 10. 98 (1H, br).

対応する出発原料を用い、実施例516と同様にして、次表に示す実施例51

7~実施例523の化合物を製造した。

表18

10

実施例	R		¹H NMR δ	収率 (%)
517	(CF ₃	CDCl_3	1.59(3H, s), 3.78(1H, d, J=8.5Hz), 3.86(1H, d, J=8.5Hz), 4.29(1H, d, J=15.1Hz), 4.57(1H, d, J=15.1Hz), 7.61(2H, d, J=8.1Hz), 7.79(2H, d, J=8.1Hz), 8.06(1H, s), 9.17(1H, br).	70
518	-0-0	CDCl_3	1.61(3H, s), 3.79 (1H, d, J=8.5Hz), 3.85(1H, d, J=8.5Hz), 4.27(1H, d, J=15.0Hz), 4.56(1H, d, J=15.0Hz), 7.33-7.63 (7H, m), 7.78(2H, d, J=8.4Hz), 8.06(1H, s), 9.02(1H, br).	82
519	-C1	CDCl ₃	1.62(3H, s), 3.75(1H, d, J=8.5Hz), 3.83(1H, d, J=8.5Hz), 4.27(1H, d, J=15.0Hz), 4.54(1H, d, J=15.0Hz), 7.34(2H, dd, J=1.8Hz, 8.6Hz), 7.63(2H, dd, J=1,8Hz, 8.6Hz), 8.03(1H, s), 9.05(1H, br).	57
520		DMSO-	1.51(3H, s), 3.66(1H, d, J=8.8Hz), 3.79(1H, d, J=8.8Hz), 4.48(2H, s), 7.24-7.41(2H, m), 7.84-7.96(2H, m), 8.52(1H, s).	64
521	~~~	CDCl ₃	1.56(3H, s), 2.41-2.53(2H, m), 2.81-3.00(2H, m), 3.56(1H, d, J=8.5Hz), 3.63(1H, d, J=8.5Hz), 4.22(1H, d, J = 15.0Hz), 4.42(1H, d, J=15.0Hz), 7.12(2H, d, J=8.4Hz), 7.26(2H, d, J=8.4Hz), 7.55(1H, br), 7.97(1H, s).	92
522	~~~cı	DMSO-	1.53(3H, s), 3.63(1H, d, J=8.8Hz), 3.77(1H, d, J=8.8Hz), 4.43(1H, d, J=15.0Hz), 4.51(1H, d, J=15.0Hz), 6.58(1H, d, J=15.9Hz), 7.43-7.55(3H, m), 7.64(2H, d, J=8.5Hz), 7.51(1H, s).	89
523	~°~	CDCl ₃	1.56(3H, s), 3.72(2H, s), 4.25(1H, d, J=15.1Hz), 4.44(1H, d, J=15.1Hz), 4.59(2H, s), 6.85(2H, dd, J=2.3Hz, 6.8Hz), 7.29(2H, dd, J=2.3Hz 6.8Hz), 7.98(1H, s), 8.49 (1H, br).	98

20

15

実施例524

実施例516で製造した3-[3-(2-クロロー4-ニトロイミダゾールー1-イル)-2-ヒドロキシー2-メチルプロピル]-5-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-3H-[1,3,4]オキサジアゾールー2-オン(3.27g、7.05ミリモル)の1,4-ジオキサン(70ml)溶液に氷冷撹拌下、水素化ナトリウム(0.37g、9.17ミリモル)を加え、3時間加熱還

流した。反応液を減圧濃縮し、氷冷し、水を加え、酢酸エチルで抽出し、硫酸マグネシムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=4/1)により精製し、アセトニトリル及びエタノールで再結晶し、白色固体の3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-5-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-3H-[1,3,4]オキサジアゾール-2-オン(1,43g、収率48%)を得た。

融点 190-191℃。

対応する出発原料を用い、実施例 5 2 4 と同様にして、実施例 5 2 5 ~ 実施例 10 5 3 1 の化合物を製造した。

実施例525

15 融点 230-231℃。

実施例526

3-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル)<math>-5-(ビフェニル-4-イル)-3H-[1, 3, 4] オキサジアゾール-2-オン

20 融点 248-249℃。

実施例527

3-(2-x+v-6-k-1) オキサゾール-2-x+v-6-k-1 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-x+v-1 - [1, 3, 4] オキサジアゾール-2-x+v-1

25 融点 221-222℃。

実施例528

3-(2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2-イルメチル) <math>-5-(4-フルオロフェニル) -3H-[1, 3, 4] オキサジアゾールー2-オン

融点 188-191℃。

実施例529

3-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル)-5- [2-(4-クロロフェニル)ビニル]-3

5 H-[1, 3, 4] オキサジアゾールー2ーオン

融点 249-252℃。

実施例530

3-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) -5-[2-(4-クロロフェニル) エチル]-3

10 H-[1, 3, 4] オキサジアゾールー2-オン

融点 139-140℃。

実施例531

3-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) -5-(4-クロロフェノキシメチル) -3 H-

15 [1, 3, 4] オキサジアゾールー2ーオン

融点 64-66℃。

実施例532

3-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2イルメチル) -5-フェニル-3 H- [1, 3, 4] オキサジアゾ

20 ールー2ーオンの製造

 $2-\rho$ ロロー4ーニトロー1 Hーイミダゾール(170 mg、1.15 ミリモル)、3-(2-メチルー2-オキシラニルメチル)-5-フェニルー3 Hー [1,3,4] オキサジアゾールー2-オン(310 mg、0.9 ミリモル)、炭酸水素ナトリウム(120 mg、1.43 nno1)及びエタノール(2

25 m1)の混合物を2.5時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、水を加え、塩化メチレンにより抽出し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣を1,4-ジオキサン(10ml)に溶解し、水素化ナトリウム(55mg、1.38ミリモル)を加え、室温下にて1時間撹拌後、1.5時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、水を加え、塩化メチレン

により抽出し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をエタノールから再結晶し、淡茶粉末の3-(2-メチル-6-1) (2 - メチル) -6-1 (2 - メチル) -5-1 (2 - メチル) -5-1 (1 2 7 mg、収率 3 2%) を得た。

融点 225-227℃。

実施例533

5

10 4] オキサジアゾール-2-オンの製造

4-メチルベンゼンスルホン酸2-メチル-2-オキシラニルメチルエステル (3.98g、18.9ミリモル)、5-(4-クロロベンジル)-3H-[1,3,4]オキサジアゾール-2-オン(5.5g、26.11ミリモル)、炭酸カリウム(3.4g、24.6ミリモル)、ヨウ化ナトリウム(3.4g、22.

15 68ミリモル)、DMF(40ml)の混合物を室温下にて21時間撹拌した。 反応液に水を加え、酢酸エチルにより2回抽出した。有機相を合わせ、3回水洗し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、黄色オイルを5.47g得た。

この黄色オイルのうちの2.3g(11.02ミリモル)、2,4ージニトロ 20 ー1Hーイミダゾール(2.26g、14.3ミリモル)、酢酸ナトリウム(1.81g、22.07ミリモル)及びエタノール(22ml)の混合物を8時間加 熱還流した。反応液を室温に戻し、水を加え、酢酸エチルにより抽出し、飽和重 曹水により洗浄後、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を 減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレ ン/酢酸エチル=3/1)により精製し、白色固体の5ー(4ークロロベンジル)-3ー(2ーメチルー6ーニトロー2,3ージヒドロイミダゾ [2,1ー b] オキサゾールー2ーイルメチル)-3H-[1,3,4] オキサジアゾールー2ーオン(240mg、9%)を得た。

融点 151-153℃。

実施例534

5-(4-) ロイミダン [2, 1-b] オキサン・ルー2ーイルメチル)-3H-[1, 3, 4] オキサジアン・ルー2ーオンの製造

- 実施例41で製造したメタンスルホン酸2-メチルー6-ニトロー2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールー2ーイルメチルエステル(1.02g、3.67ミリモル)、5ー(4ーブロモフェニル)-3Hー[1,3,4]オキサジアゾールー2ーオン(680mg、2.82ミリモル)、炭酸カリウム(580mg、4.2ミリモル)、ヨウ化ナトリウム(890mg、5.9
- 10 4ミリモル)及びDMF(15ml)の混合物を100℃にて3時間撹拌した。 反応液を室温に戻し、水を加え、酢酸エチルで2回抽出した。有機相を合わせ、 水で3回洗浄後,硫酸マグネシムで乾燥した後、濾過した。濾液を減圧濃縮した。 残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=9/ 1)により精製し、微黄色粉末の5-(4-ブロモフェニル)-3-(2-メチ
- 15 ルー6ーニトロー2、3ージヒドロイミダゾ [2、1ーb] オキサゾールー2ーイルメチル) -3H-[1、3、4] オキサジアゾールー2ーオン(17.4 mg、収率2%)を得た。

融点 231-233℃。

実施例535

20 5-(4-プロモフェニル)-3-(6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル)-3H-[1, 3, 4] オキサ ジアゾール-2-オンの製造

実施例40で製造したメタンスルホン酸6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステル(3.28g、12.

25 46ミリモル)及び5-(4-ブロモフェニル)-3H-[1,3,4]オキサジアゾール-2-オン(1.5g、6.22ミリモル)を用い、実施例534の方法により、淡茶粉末の5-(4-ブロモフェニル)-3-(6-ニトロー2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-3H-[1,3,4]オキサジアゾール-2-オン(312mg、収率12%)を得た。

融点 264℃(分解)。

対応する出発原料を用い、実施例535と同様にして、実施例536の化合物を製造した。

実施例536

5 3-(6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2 ーイルメチル) -5-(4-トリフルオロメトキシフェニル) -3H-[1, 3, 4] オキサジアゾール-2-オン

融点 204-207℃。

実施例537

3-[2-(2-メチル-6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイル) エチル] -5-(ピリジン-4ーイル) -3H-[1, 3, 4] オキサジアゾールー2ーオンの製造

5-(ピリジン-4-イル)-3H-[1, 3, 4] オキサジアゾールー2ーオン(150mg、0.92ミリモル)、水素化ナトリウム(41mg、1.0

- 3ミリモル)及びDMF(1.5ml)の混合物を室温下にて1時間撹拌した。 反応液に、実施例42で製造したメタンスルホン酸2-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イル)エチルエステル(200mg、0.69ミリモル)、ヨウ化ナトリウム(140mg、0.93ミリモル)の順に加え、50-60℃にて6時間撹拌した。反応液を室
- 20 温に戻し、水を加え、酢酸エチルで2回抽出した。有機相を合わせ、水で3回洗 浄後、硫酸マグネシムで乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧濃縮し、残渣を シリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=25/1) により精製し、白色粉末の3-[2-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒ ドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イル)エチル]-5-(ピリジ

融点 147-149℃。

対応する出発原料を用い、実施例537と同様にして、実施例538の化合物を製造した。

実施例538

3-[2-(2-メチル-6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイル) エチル] <math>-5-(ピラジン-2-イル) -3H-[1, 3, 4] オキサジアゾールー2ーオン

5 融点 209-212℃。

実施例539

- (R) -3-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル] <math>-5-(4-トリフルオロメトキシフェニル) -3H-[1,3,4] オキサジアゾール-2-オンの製造
- 10 5-(4-トリフルオロメトキシフェニル) -3H-[1, 3, 4] オキサジアゾール-2-オン(0.68g、2.76ミリモル)及び実施例12で製造した(R) -2-クロロー1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル) -4-ニトロイミダゾール(0.50g、2.30ミリモル)のDMF(5ml)溶液に炭酸カリウム(0.38g、2.76ミリモル)を加え、室温で16時間撹拌し
- た。水を加え、酢酸エチルで抽出し、硫酸マグネシムで乾燥後、減圧濃縮した。 残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=4/1)により精製し、白色アモルファスの(R)-3-[3-(2-クロロー4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシー2-メチルプロピル]-5-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-3H-[1,3,4]オキサジアゾ
- 20 一ルー2ーオン(1.06g、定量的)を得た。

 1 H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

1. 53 (3H, s), 3. 67 (1H, d, J=8. 8Hz), 3. 81 (1 H, d, J=8. 8Hz), 4. 49 (2H, s), 7. 42-7. 66 (2H, m), 7. 86-8. 09 (2H, m), 8. 54 (1H, s), 10. 98

25 (1H, br).

実施例540

(R) -3-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル) <math>-5-(4-トリフルオロメトキシフェニル) -3H-[1, 3, 4] オキサジアゾールー2ーオンの製造

実施例539で製造した(R) -3-[3-(2-クロロー4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-ヒドロキシー2ーメチルプロピル] -5-(4ートリフルオロメトキシフェニル) -3H-[1, 3, 4] オキサジアゾールー2ーオン(0.87g、1.88ミリモル)の1,4ージオキサン(18ml)溶液に 氷冷撹拌下、水素化ナトリウム(98mg、2.44ミリモル)を加え、5時間加熱還流した。減圧濃縮し、氷冷し、水を加え、酢酸エチルで抽出し、硫酸マグネシムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=9/1)により精製し、アセトニトリル/イソプロパノールから再結晶し、白色粉末結晶の(R) -3-(2-メチルー6-ニト10ロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b] オキサゾールー2ーイルメチル) -5-(4ートリフルオロメトキシフェニル) -3H-[1,3,4] オキサジアゾールー2ーオン(0.32g、収率40%)を得た。

光学純度 98.2%ee

 $[\alpha]_D^{26} = -12.43^{\circ}$ (濃度: 0.668, CHCl₃)

15 融点 146-148℃。

実施例541

2ークロロー4ーニトロー1Hーイミダゾール(503mg、3.41ミリモ 20 ル)、3ー(2ーメチルー2ーオキシラニルメチル)-3Hーベンゾオキサゾールー2ーオン(700mg、3.41ミリモル)のエタノール(7m1)懸濁液に酢酸ナトリウム(336mg、4.1ミリモル)を加え、8時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、水を加え、塩化メチレンにより抽出し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲル

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 31 (3H, s), 3. 04 (1H, s), 3. 87 (1H, d, J=14. 7Hz), 3. 98 (1H, d, J=14. 7Hz), 4. 13 (1H, d, J=12. 5Hz), 4. 24 (1H, d, J=14. 5Hz), 7. 08-7. 31 (4H, m), 8. 04 (1H, s).

5 対応する出発原料を用い、実施例 5 4 1 と同様にして、次表に示す実施例 5 4 2 及び実施例 5 4 3 の化合物を製造した。

表19

10

実施例	R	¹H NMR δ		
542	Cl	CDCl ₃	1.32(3H, s), 3.14(1H, s), 3.87(1H, d, J=14.7Hz), 3.95 (1H, d, J=14.7Hz), 4.11(1H, d, J=14.4Hz), 4.25(1H, d, J=14.4Hz), 7.10-7.23(3H, m), 8.03(1H, s).	(%) 35
543	F	CDCl ₃	1.11(3H, s), 2.66(1H,s), 3.86(1H, d, J=14.5Hz), 3.94(1H, d, J=14.5Hz), 4.16(1H, d, J=14.3Hz), 4.24(1H, d, J=14.3Hz), 6.89-7.00(1H, m), 7.29 (1H, dd, J=2.7Hz, 8.8Hz), 7.37(1H, dd, J=4.4Hz, 8.8Hz), 8.01(1H,s).	33

15

実施例544

3- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) -3H-ベンゾオキサゾール-2-オンの製造

20 実施例 5 4 1 で製造した 3 ー [3 ー (2 ークロロー4 ーニトロイミダゾールー1 ーイル) ー 2 ーヒドロキシー2 ーメチルプロピル] ー 3 Hーベンゾオキサゾールー2 ーオン (6 1 5 m g、1. 7 4 ミリモル)、水素化ナトリウム (7 6. 6 m g、1. 9 1 ミリモル)、1, 4 ージオキサン (1 5 m 1)の混合物を1時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、水を加え、塩化メチレンにより抽出し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=30/1)により精製し、白色粉末の3 ー (2 ーメチルー6 ーニトロー2, 3 ージヒドロイミダゾ [2, 1 ー b] オキサゾールー2 ーイルメチル)ー3 Hーベンゾオキサゾールー2 ーオン (2 0 9 m g、収率3 8%)を得た。

融点 222.7-224.3℃。

対応する出発原料を用い、実施例544と同様にして、実施例545及び実施例546の化合物を製造した。

実施例545

融点 207.6-207.9℃。

実施例546

10 5-フルオロ-3-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル) <math>-3H-ベンゾオキサゾールー2ーオン

融点 246.2-246.8℃。

実施例547

15 5-ブロモー3- (2-メチル-6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2-イルメチル)-3 H-ベンゾオキサゾールー2-オンの製造

2-クロロー4-ニトロー1 H-イミダゾール(3. 2 2 g 、2 1 . 8 ミリモル)、5-プロモー3-(2-メチルー2-オキシラニルメチル)- 3 H-ベン

- 20 ゾオキサゾールー2ーオン(6.2g、21.8ミリモル)、酢酸ナトリウム (1.97g、24ミリモル)、エタノール(50ml)の混合物を8時間加熱 還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に水を加え、塩化メチレンにより抽出し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧濃縮し、残渣を1,4-ジオキサン60mlに溶解し、水素化ナトリウム
- 25 (528mg、13.21ミリモル)を加え、70-80℃にて17時間撹拌した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に水を加え、塩化メチレンにより抽出し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=30/1)により精製し、白色粉末の5-ブロモ-3-(2-メチル

-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) -3 H-ベンゾオキサゾール-2-オン(1.82 g、収率3.7%)を得た。

融点 243-245.5℃。

5 実施例548

5-(2-クロロー4ーニトロイミダゾールー1ーイルメチル) -3-(4ーヒドロキシビフェニルー3ーイル) -5-メチルオキサゾリジンー2ーオンの製造2-クロロー4ーニトロー1Hーイミダゾール(1.3g、8.78ミリモル)、5-フェニルー3-(2-メチルー2ーオキシラニルメチル) -3Hーベ10 ンゾオキサゾールー2ーオン(2.47g、8.78ミリモル)、酢酸ナトリウム(792mg、9.66ミリモル)及びエタノール(30ml)の混合物を10時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に水を加え、塩化メチレンにより抽出し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=10/1)により精製し、白色粉末の5-(2-クロロー4ーニトロイミダゾールー1ーイルメチル) -3-(4ーヒドロキシー3ービフェニリル) -5-メチルオキサゾリジン-2-オン(1.82g、収率61%)を得た。

 1 H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

- 20 1. 55 (3H, s), 3. 85 (1H, d, J=9. 5Hz), 3. 98 (1 H, d, J=9. 5Hz), 4. 46 (1H, d, J=14. 9Hz), 4. 5 6 (1H, d, J=14. 9Hz), 6. 99 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 27 (1H, t, J=7. 3Hz), 7. 36-7. 57 (6H, m), 8. 52 (1H, s), 10. 06 (1H, s).
- 25 実施例549

3-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル)-5-フェニル-3H-ベンゾオキサゾール-2-オンの製造

実施例548で製造した5-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イ

WO 2004/033463 PCT/JP2003/013070

ルメチル) -3-(4-ヒドロキシ-3-ビフェニリル) -5-メチルオキサゾ リジン-2-オン (1.23g、2.88ミリモル)、水素化ナトリウム (12 7 mg、3. 16ミリモル)及びDMF(10 ml)の混合物を100℃にて4 時間撹拌した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に水を加え、塩 化メチレンにより抽出した。有機相を水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸マ グネシウムにより乾燥し、次いで減圧濾過した。濾液を減圧濃縮し、残渣をシリ カゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=20/1)によ り精製し、黄茶色粉末結晶の3-(2-メチルー6-ニトロー2,3-ジヒドロ イミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2-イルメチル) -5-フェニルー3H

ーベンゾオキサゾールー2-オン(172mg、収率15%)を得た。 10

融点 254-254.6℃。

実施例550

15

3-[2-(2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1b] オキサゾールー2ーイル) エチル] -3H-ベンゾオキサゾール-2-オン の製造

2-ベンブオキサゾリノン (240mg、1.8ミリモル)、水素化ナトリウ ム (67mg、1.95ミリモル)及びDMF (10ml) の混合物を室温下に て30分撹拌した。反応液に実施例42で製造したメタンスルホン酸2- (2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾールー 2-イル) エチルエステル $(500 \,\mathrm{mg}\, \mathrm{c}\, 1.7 \,\mathrm{c}\, \mathrm{J}\, \mathrm{E}\, \mathrm{m}\, \mathrm{c}\, \mathrm{c}\, 50-60$ 20 ℃にて4時間撹拌した。反応液を室温に戻し、氷水中に注いだ。析出晶を濾取し、 エタノールから再結晶することにより、淡茶粉末の3- [2-(2-メチルー6 ーニトロー2, 3ージヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイル) エチル] - 3 H - ベンゾオキサゾールー 2 - オン (320 mg、収率 56%)を 25 得た。

融点 193-195℃。

実施例 5 5 1

3-[5-(2-クロロー4-ニトロイミダゾールー1-イル)-4-ヒドロキ シー4ーメチルペンチル] -3H-ベンゾオキサゾール-2-オンの製造

3-[3-(2-メチルー2-オキシラニル)プロピル]-3H-ベンゾオキサゾールー2-オン(3.8g、16.3ミリモル)を用い、実施例<math>541の方法により、白色粉末の3-[5-(2-クロロー4-ニトロイミダゾールー1ーイル)-4-ヒドロキシー4-メチルペンチル]-3H-ベンゾオキサゾールー

5 2-オン(3.5g、68%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 20 (3H, s), 1. 49-1. 70 (2H, m), 1. 88-2. 07 (2H, m), 2. 68 (1H, s), 3. 81-3. 93 (2H, m), 4. 00 (2H, s), 6. 98 (1H, d, J=7. 3Hz), 7. 09-7. 2

10 6 (3H, m), 8.00 (1H, s).

実施例552

3- [6-(2-クロロー4-ニトロイミダゾール-1-イル) -5-ヒドロキ シ-5-メチルヘキシル] -3H-ベンゾオキサゾール-2-オンの製造

3-[4-(2-メチル-2-オキシラニル)ブチル]-3H-ベンゾオキサ

15 ゾールー2ーオン (1.2g、4.86ミリモル)を用い、実施例541の方法により、白色粉末の3-[6-(2-クロロー4-ニトロイミダゾールー1-イル)-5-ヒドロキシー5-メチルヘキシル]-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン (1.2g、62%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

20 1. 16 (3H, s), 1. 38-1. 58 (4H, m), 1. 67-1. 86 (2H, m), 2. 15 (1H, s), 3. 87 (2H, t, J=6. 6Hz), 3. 98 (2H, s), 6. 98 (1H, d, J=7. 8Hz), 7. 08-7. 26 (3H, m), 8. 01 (1H, s).

実施例553

25 3-[3-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イル)プロピル]-3H-ベンゾオキサゾール-2-オンの製造

実施例551で製造した3-[5-(2-クロロー4-ニトロイミダゾールー1-イル)-4-ヒドロキシー4-メチルペンチル]-3H-ベンゾオキサゾー

ルー2ーオン (3.5 g、9.2 ミリモル)を用い、実施例544の方法により、微黄色粉末の3ー[3-(2-メチルー6-ニトロー2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールー2ーイル)プロピル<math>]-3H-ベンゾオキサゾールー2ーオン (2.4 g、収率76%)を得た。

5 融点 180-181℃。

実施例554

3-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イル)ブチル<math>]-3H-ベンゾオキサゾール-2-オンの製造

実施例552で製造した3-[6-(2-クロロー4ーニトロイミダゾールー1ーイル) -5-ヒドロキシー5-メチルヘキシル] -3Hーベンゾオキサゾールー2ーオン(1.2g、3ミリモル)を用い、実施例544の方法により、微黄色粉末の3-[4-(2-メチルー6ーニトロー2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b] オキサゾールー2ーイル)ブチル] -3Hーベンゾオキサゾール15-2ーオン(780mg、収率72%)を得た。

融点 155-158℃。

実施例555

20 - 2 - オンの製造

1-メチル-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン(1. 41g、6. 46ミリモル)を用い、実施例541の方法により、白色粉末結晶の1-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]-3-メチ

25 ルー1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾールー2ーオン(1.23g、収率63%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 23 (3H, s), 3. 47 (3H, s), 3. 94 (1H, d, J=12. 4Hz), 4. 03 (1H, d, J=12. 4Hz), 4. 06 (1H, d, J=12. 4Hz)

=11.9Hz), 4.17 (1H, d, J=11.9Hz), 4.79 (1H, s), 7.00-7.21 (4H, m), 8.09 (1H, s).

対応する出発原料を用い、実施例555と同様にして、次表に示す実施例556~実施例565の化合物を製造した。

5 表20

	実施例	R	R'	¹H NMR δ	収率 (%)
10	556	04	н	1.23(3H, s), 1.51(9H, s), 1.75-1.89(2H, m), 2.17(2H, s), 2.20-2.41(2H, m), 2.75-2.91(2H, m), 3.90(1H, d, J=14.2Hz), 4.16(1H, d, J=14.2Hz), 4.25-4.50(3H, m), 7.00-7.23(4H, m), 8.09(1H, s).	78
	557	Me	6-C1	1.24(3H, s), 3.45(3H, s), 3.94(2H, s), 4.06(1H, d, J=14.4Hz), 4.18(1H, d, J=14.4Hz), 6.96(1H, d, J=8.4Hz), 7.06(1H, d, J=1.9Hz), 7.16(1H, dd, J=1.9Hz), 8.4 Hz), 8.08(1H, s)	69
15	558	Me	6-CF ₃	1.26(3H, s), 3.51(3H, s), 3.95(1H, d, J=8.5Hz), 4.03 (1H, d, J=8.5Hz), 4.14(1H, d, J=14.3Hz), 4.21(1H, d, J=14.3Hz), 7.13(1H, d, J=8.3Hz), 7.31(1H, s), 7.48 (1H, d, J=8.3Hz), 8.07(1H, s).	61
	559	Me	5-C1	1.23(3H, s), 3.47(3H, s), 3.91(1H, d, J=14.8Hz), 3.99 (1H, d, J=14.8Hz), 4.05(1H, d, J=14.0Hz), 4.17(1H, d, J=14.0Hz), 6.97(1H, d, J=8.4Hz), 7.06(1H, d, J=1.9Hz), 7.14(1H, dd, J=1.9Hz, 8.4Hz), 8.07(1H, s).	56
	560	Me	6-F	1.24(3H, s), 3.46(3H, s), 3.90(1H, d, J=14.8Hz), 3.97 (1H, d, J=14.8Hz), 4.06(1H, d, J=14.3Hz), 4.17(1H, d, J=14.3Hz), 6.79-7.00(3H, m), 8.08(1H, s).	63
20	561	Et	6-C1	1.21(3H, s), 1.36(3H, t, J=7.2Hz), 3.84-4.20(6H, m), 6.98(1H, d, J=8.4Hz), 7.06(1H, d, J=1.8Hz), 7.15 (1H, dd, J=1.8Hz, 8.4Hz), 8.08(1H, s).	77
	562	isopropyl	6-C1	1.24(3H, s), 1.55(6H, d, J=7.0Hz), 3.93(2H, s), 4.06 (1H, d, J=14.3Hz), 4.17(1H, d, J=14.3Hz), 4.55-4.75 (1H, m), 7.05(1H, s), 7.18(2H, s), 8.09(1H, s).	69
	563	Ме	6-NMe ₂	1.23(3H, s), 2.96(6H, s), 3.42(3H, s), 3.89(1H, d, J=14.8Hz), 3.99(1H, d, J=14.8 Hz), 4.05(1H, d, J=14.3 Hz), 4.16(1H, d, J=14.3Hz), 6.39(1H, d, J= 2.2Hz), 6.60(1H, dd, J=2.2Hz, 8.6Hz), 6.92(1H, d, J=8.6Hz), 8.10(1H, s).	粗製
25	564	n-hexyl	6-Cl	0.87(3H, t, J=6.9Hz), 1.16-1.39(9H, m), 1.64 - 1.82 (2H, m), 3.80-3.93(4H, m), 4.05(1H, d, J=14.3Hz), 4.17(1H, d, J=14.3Hz), 6.97(1H, d, J=8.4Hz), 7.06 (1H, d, J=1.8Hz), 7.14(1H, dd, J=1.8Hz, 8.4Hz), 8.08 (1H, s).	55
	565	Me	6-CO _z Et	1.25 (3H, s), 1.42 (3H, t, J=7.1Hz), 3.50 (3H, s), 3.93-4.11 (3H, m), 4.20 (1H, d, J=14.3Hz), 4.40 (2H, q. J=7.1Hz), 7.07 (1H, d, J=8.3Hz), 7.75 (1H, d, J=1.5Hz), 7.94 (1H, dd, J=1.5Hz, 8.3Hz), 8.07 (1H, s).	48

実施例566

1ーメチルー3ー(2ーメチルー6ーニトロー2,3ージヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールー2ーイルメチル)ー1,3ージヒドロベンゾイミダゾールー2ーオンの製造

実施例555で製造した1-[3-(2-クロロー4ーニトロイミダゾールー1ーイル) -2-ヒドロキシー2ーメチルプロピル] -3ーメチルー1, 3ージヒドロベンゾイミダゾールー2ーオン(1.23g、3.37ミリモル)を用い、実施例544の方法により、白色粉末結晶の1ーメチルー3ー(2ーメチルー6ーニトロー2, 3ージヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールー2ーイルメ チル) -1, 3ージヒドロベンゾイミダゾールー2ーオン(563mg、収率51%)を得た。

融点203.2-204.4℃。

対応する出発原料を用い、実施例 5 6 6 と同様にして、実施例 5 6 7 ~実施例 5 7 6 の化合物を製造した。

15 実施例 5 6 7

1-(1-tert-ブトキシカルボニルピペリジン-4-イル)-3-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ <math>[2, 1-b] オキサゾールー 2-イルメチル)-1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン 融点 218-219. 1 \mathbb{C} 。

20 実施例 5 6 8

 $5-\rho$ ロロー1-メチルー3-(2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2-イルメチル)-1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾールー2-オン

融点 261.9-265.4℃(分解)。

25 実施例 5 6 9

1-メチル-3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イルメチル)-5-トリフルオロメチル-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン

融点 232.4-234.7℃。

実施例570

 $6-\rho$ ロロー1-メチルー3-(2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2-イルメチル)-1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾールー2-オン

5 融点 261.3-263.3℃。

実施例571

5-7ルオロ-1-メチル-3-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ $\begin{bmatrix} 2 \\ 1 \end{bmatrix}$ 1-b $\end{bmatrix}$ オキサゾール-2-イルメチル)-1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン

10 融点 244.2-249.8℃(分解)。

実施例572

 $5-\rho$ ロロー1-エチルー3-(2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2-イルメチル)-1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾールー2-オン

15 融点 240.9-245.6℃。

実施例 5 7 3

 $5-\rho$ ロロー1-イソプロピルー3-(2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2-イルメチル)-1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾールー2-オン

20 融点 240.5-244.8℃。

実施例574

5-iiyチルアミノー1-iyチルー3-(2-iy) ヒドロイミダブ [2, 1-b] オキサゾールー2-iイルメチル)-1, 3-iビドロベンブイミダブールー2-i

25 融点 264.6-268.3℃(分解)。

実施例575

融点 168.1-169.3℃。

実施例576

5-x+2カルボニルー1-xチルー3-(2-xチルー6-x+2-2, 3-x+20 (2-xチルー6-x+2-2) (2-xチルー6-x+2-3) (2-x+2) (2

融点 265.8-266.7℃。

実施例577

5

15

1-(2-メチル-6-ニトロー2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-3-フェニル-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾ

10 ールー2ーオンの製造

1-(2-メチルー2-オキシラニルメチル)-3-フェニルー1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾールー2-オン(758mg、2. 7ミリモル)を用い、実施例200の方法により、白色粉末結晶の1-(2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2-イルメチル)-3-フェニルー1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾールー2-オン(70mg、 $\sqrt{2}$ \sqrt

融点 234.5-234.7℃。

対応する出発原料を用い、実施例577と同様にして、実施例578の化合物 を製造した。

20 実施例578

%) を得た。

1-(4-7)ルオロフェニル)-3-(2-3)チルー6-2トロー2, 3-3ビドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2-4ルメチル)-1, 3-3ビドロベンゾイミダゾールー2-3オン

融点 254.1-254.7℃。

25 実施例579

1-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル)-(3-ピペリジン-4-イル)-1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オンの製造

実施例567で製造した1- (1-tert-ブトキシカルボニルピペリジン

-4-イル)-3-(2-メチルー6-ニトロー2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールー2ーイルメチル)-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾールー2ーオン(371mg、0.74ミリモル)、トリフルオロ酢酸1ml及び塩化メチレン(10ml)の混合物を室温下にて2時間撹拌した。反応液を減圧下にて濃縮した。残渣に飽和重曹水を加え、塩基性とし、析出晶を濾取した。析出晶を繰り返し水洗することにより、微黄色粉末結晶の1-(2-メチルー6-ニトロー2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールー2ーイルメチル)-3-(ピペリジン-4-イル)-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾールー2ーオン(255mg、収率86%)を得た。

10 融点 192.3-198.8℃(分解)。

実施例580

4- [3-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) -2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-1-イル] ピペリジン-1-カルボン酸ベンジルエステルの製造

- 実施例579で製造した1-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル)-3-(ピペリジン-4-イル)-1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン(90mg、0.23!リモル)及び塩化メチレン(5ml)の混合物に、氷冷下にてトリエチルアミン(75mg、0.74ミリモル)、クロロギ酸ベンジル(126mg、0.25mg、0.74ミリモル)、クロロギ酸ベンジル(126mg、0.25mg 0.25mg 0.25
- 20 74ミリモル)の順に加え、室温下にて3時間撹拌した。反応液を水、飽和重曹水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(nーペキサン/アセトン=1/1)により精製し、白色粉末結晶の4-[3-(2ーメチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダブ[2,1-b]オキサゾール
- 25 -2-イルメチル)-2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-1-イル] ピペリジン-1-カルボン酸ベンジルエステル($25\,\mathrm{mg}$ 、収率 $21\,\%$)を得た。

融点 181.7-184.6℃。

実施例581

1ーベンジルー3ー[3ー(2ークロロー4ーニトロイミダゾールー1ーイル) ー2ーヒドロキシー2ーメチルプロピル] イミダゾリジンー2ーオンの製造 1ーベンジルー3ー(2ーメチルー2ーオキシラニルメチル) イミダゾリジン ー2ーオン(680mg、2.76ミリモル)を用い、実施例541の方法によ り、白色粉末結晶の1ーベンジルー3ー[3ー(2ークロロー4ーニトロイミダ ゾールー1ーイル) ー2ーヒドロキシー2ーメチルプロピル] イミダゾリジンー 2ーオン(580mg、収率59%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 18 (3H, s), 3. 17-3. 54 (6H, m), 4. 07 (2H,

10 s), 4. 37 (2H, s), 7. 17-7. 40 (5H, m), 8. 13 (1 H, s).

対応する出発原料を用い、実施例581と同様にして、次表に示す実施例58 2~実施例587の化合物を製造した。

表21

15

20

25

実施例	R (solvent)	¹H NMR δ	収率 (%)
582	CDCl ₃	1.19(3H, s), 3.16-3.52(6H, m), 4.06(2H, s), 4.33(2H, s), 6.93-7.09(2H, m), 7.18-7.30(2H, m), 8.13(1H, s).	43
583	CDCl ₃	1.19(3H, s), 3.16-3.55(6H, m), 4.05(2H, s), 4.31(2H, s), 7.14 (2H, dd, J=2.0Hz, 8.6Hz), 7.46(2H, dd, J=2.0Hz, 8.6Hz), 8.13 (1H, s).	64
584	OMSO-d ₆	1.03(3H, s), 3.02-3.27(4H, m), 3.39-3.55(2H, m), 3.73(3H, s), 4.03(2H, s), 4.29(2H, s), 6.90(2H, d, J=8.6Hz), 7.17(2H, d, J=8.6Hz), 8.48(1H, s).	69
585	DMSO-d ₆	1.04(3H, s), 3.05-3.25(4H, m), 3.36-3.48(2H, m), 4.03(2H, s), 4.22(2H, s), 7.28(2H, d, J=8.3Hz), 7.41(2H, d, J=8.3Hz), 8.48(1H, s).	60
586	CDCl ₃	1.16(3H, s), 1.59-1.84(4H, m), 2.00-2.18(2H, m), 2.89-3.02 (2H, m), 3.09-3.50(8H, m), 3.61-3.80(1H, m), 4.00(1H, d, J=14.3Hz), 4.09(1H, d, J=14.3Hz), 7.18-7.36(5H, m), 8.12 (1H, s).	粗製
587	DMSO-d ₆	1.03(3H, s), 3.05-3.23(4H, m), 3.30-3.50(2H, m), 3.75(3H, s), 3.77(3H, s), 4.02(2H, s), 4.20(2H, s), 6.47(1H, dd, J=2.2Hz, 8.3Hz), 6.56(1H, d, J=2.2Hz), 7.06(1H, d, J=8.3Hz), 8.48 (1H, s).	58

実施例588

1ーベンジルー3ー(2ーメチルー6ーニトロー2, 3ージヒドロイミダゾ[2,

1-b] オキサゾール-2-イルメチル) イミダゾリジン-2-オンの製造

実施例5.81で製造した1-ベンジル-3-[3-(2-クロロー4-ニトロ

5 イミダゾールー1ーイル) ー2ーヒドロキシー2ーメチルプロピル] イミダゾリジンー2ーオン(580mg、1.47ミリモル)を用い、実施例544の方法により、白色粉末結晶のの1ーベンジルー3ー(2ーメチルー6ーニトロー2,3ージヒドロイミダゾ[2,1ーb] オキサゾールー2ーイルメチル) イミダゾリジンー2ーオン(395mg、収率75%)を得た。

10 融点 180.2-180.9℃。

対応する出発原料を用い、実施例588と同様にして、実施例589~実施例594の化合物を製造した。

実施例589

1-(4-フルオロベンジル)-3-(2-メチル-6-ニトロー2, 3-ジヒ

15 ドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル) イミダゾリジンー 2ーオン

融点 182.5-183.3℃。

実施例590

1-(4-ブロモベンジル)-3-(2-メチル-6-ニトロー2, 3-ジヒド 20 ロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) イミダゾリジン-2 ーオン

融点 205.7-208.1℃。

実施例591

1-(4-メトキシベンジル)-3-(2-メチル-6-ニトロー2, 3-ジヒ 25 ドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) イミダゾリジン-2-オン

融点 158.6−160.5℃。

実施例592

1-(4-クロロベンジル)-3-(2-メチル-6-ニトロー2, 3-ジヒド

ロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2-イルメチル) イミダゾリジン-2 ーオン

融点 208.7-209.8℃。

実施例593

5 1- (1-ベンジルピペリジン-4-イル) -3- (2-メチル-6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) イミダゾリジン-2-オン

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 41-1. 72 (7H, m), 1. 97-2. 10 (2H, m), 2. 88

10 -2. 95 (2H, m), 3. 08-3. 30 (4H, m), 3. 43-3. 7 0 (4H, m), 3. 81 (1H, d, J=15. 0Hz), 3. 91 (1H, d, J=10. 3Hz), 4. 51 (1H, d, J=10. 3Hz), 7. 13 -7. 31 (5H, m), 7. 47 (1H, s).

実施例594

15 1-(2, 4-i) 4-i) 1-(2, 4-i) 1-(2-i) 1-(2-i)

融点 175-175.4℃。

実施例595

- 20 1-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル)-3-フェニルイミダゾリジン-2-オンの製造 1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-3-フェニルイミダゾリジン-2-オン (300mg、1.29ミリモル)を用い、実施例200の方法により、白色粉末結晶の1-(2-メチル-6-ニトロ-2、3-ジヒドロイミダゾ
- 25 [2, 1-b] オキサゾールー 2 ーイルメチル) -3 ーフェニルイミダゾリジン -2 ーオン(59 m g、収率 2 6%)を得た。

融点 194.8-197.4℃。

実施例596

1-(2-メチル-6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキ

サゾールー2-イルメチル) イミダブリジン-2-オンの製造

実施例 594で製造した1-(2,4-i) メトキシベンジル)-3-(2-i) チル-6-i トロ-2,3-i ヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2 -1 ーイルメチル)イミダゾリジン-2- オン(100 mg、0.24 ミリモル)、

5 トリフルオロ酢酸2m1及び塩化メチレン (2m1) の混合物を室温下にて1時間撹拌した。反応液に飽和重曹水を加え中和し、塩化メチレンにより抽出し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をジエチルエーテル処理することにより得られる結晶を濾取し、白色粉末結晶の1-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールー2-イルメチル)イミダゾリジン-2-オン(50mg、収率78

融点 224.8-229.1℃(分解)。

実施例597

%)を得た。

3- (2-メチル-6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキ サゾール-2-イルメチル) オキサゾリジン-2-オンの製造

15 3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)オキサゾリジン-2-オン(2. 87g、18.23ミリモル)、2-クロロー4-ニトロー1H-イミダゾール (2. 7g、18. 23ミリモル)、酢酸ナトリウム (1. 64g、20. 05 ミリモル)及びエタノール (30ml) の混合物を10時間加熱還流した。反応 液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に塩化メチレンを加え、水、飽和重 20 曹水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、減圧濾過 した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣を1,4-ジオキサン50mlに溶解し、 水素化ナトリウム(610mg、15.25ミリモル)を加え、終夜加熱還流し た。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に水を加え、塩化メチレン により抽出し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧 25 下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メ タノール=20/1)により精製し、白色粉末の3-(2-メチルー6-ニトロ -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル)オ キサゾリジン-2-オン(1.54g、収率40%)を得た。

 1 H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

1. 59 (3H, s), 3. 46-3. 71 (4H, m), 4. 11-4. 30 (4H, m), 8. 15 (1H, s).

実施例598

- 5 5ーアジドメチルー3ー [3ー(2ークロロー4ーニトロイミダゾールー1ーイル) ー2ーヒドロキシー2ーメチルプロピル] オキサゾリジンー2ーオンの製造2ークロロー4ーニトロー1Hーイミダゾール(350mg、2.37ミリモル)、5ーアジドメチルー3ー(2ーメチルー2ーオキシラニルメチル)オキサゾリジンー2ーオン(500mg、2.37ミリモル)、酢酸ナトリウム(21
- 10 4mg、2.61ミリモル)及びエタノール(5ml)の混合物を70℃にて8時間撹拌した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に水を加え、塩化メチレンにより抽出し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(nーヘキサン/酢酸エチル=1/2)により精製し、微黄色オイルの5-アジドメチルー
- 3-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシー2-メチルプロピル]オキサゾリジン-2-オン(640mg、収率75%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 23 (3H, s), 3. 17-3. 35 (2H, m), 3. 43-3. 61 20 (2H, m), 3. 67-3. 84 (2H, m), 4. 01-4. 16 (2H, m), 4. 68-4. 81 (1H, m), 8. 04 (1H, s).

実施例599

5-アジドメチル-3-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) オキサゾリジン-2-オンの製

25 造

実施例 598で製造した 5-アジドメチルー3-[3-(2-クロロー4-ニトロイミダゾールー1-イル) -2-ヒドロキシー2-メチルプロピル] オキサゾリジンー2-オン (1g, 2.78ミリモル) を1,4-ジオキサン10m1に溶解し、水素化ナトリウム (130mg, 3.25ミリモル) を加え、80°C

にて4時間撹拌した。反応液を室温に戻し、水を加え、減圧下にて濃縮した。残 渣に水を加え、塩化メチレンにより抽出し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、 減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラ フィー(塩化メチレン/酢酸エチル=20/1)により精製し、淡茶色粉末結晶 の5ーアジドメチルー3ー(2ーメチルー6ーニトロー2,3ージヒドロイミダ ゾ[2,1ーb]オキサゾールー2ーイルメチル)オキサゾリジンー2ーオン (46mg、収率5%)を得た。

 $MS 323 (M^{+})$

実施例600

10 1-[3-(2-クロロー4-ニトロイミダゾールー1ーイル) -2-ヒドロキシー2-メチルプロピル] -1, 4-ジヒドロベンゾ [d] [1, 3] オキサジン-2-オンの製造

[d] [1, 3] オキサジン-2-オン(5.13g、23.04ミリモル)を

15 用い、実施例 5 4 1 の方法により、微黄色油状物の 1 ー [3 ー (2 ー クロロー 4 ーニトロイミダゾールー 1 ーイル) ー 2 ーヒドロキシー 2 ーメチルプロピル] ー 1,4 ージヒドロベンゾ [d] [1,3] オキサジンー 2 ーオン (1.5 4 g、収率 3 6%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

20 1. 23 (3H, s), 3. 96 (1H, br), 4. 04-4. 20 (4H, m), 5. 28 (2H, s), 7. 00-7. 07 (1H, m), 7. 11-7. 24 (2H, m), 7. 30-7. 43 (1H, m), 8. 07 (1H, s)。 実施例601

1-(2-メチル-6-ニトロ2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサ25 ゾール-2-イルメチル)-1, 4-ジヒドロベンゾ [d] [1, 3] オキサジン-2-オンの製造

- い、実施例 5 4 4 の方法により、微褐色固体の 1 ー (2 ーメチルー 6 ーニトロー 2, 3 ージヒドロイミダゾ [2, 1 ー b] オキサゾールー 2 ーイルメチル) ー 1, 4 ージヒドロベンゾ [d] [1, 3] オキサジンー 2 ーオン (0.58g、収率 4 2%) を得た。
- 5 融点 230-231℃。

実施例602

- 10 3,3-ジフルオロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1,3-ジヒドロインドール-2-オン(1.14g、4.76ミリモル)を用い、実施例541の方法により、白色粉末の1-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]-3,3-ジフルオロ-1,3-ジヒドロインドール-2-オン
- 15 (968mg、収率53%)を得た。

 $^{1}H-NMR$ (DMSO-d₆) δ p pm:

- 1. 09 (3H, s), 3. 73 (1H, d, J=14.5Hz), 3. 87 (1H, d, J=14.5Hz), 4. 13 (1H, d, J=14.4Hz),
- 4. 21 (1H, d, J = 14.4Hz), 5. 39 (1H, s), 7. 20-
- 20 7. 26 (1H, m), 7. 33-7. 37 (1H, m), 7. 57-7. 64 (1H, m), 7. 67-7. 71 (1H, m)

対応する出発原料を用い、実施例602と同様にして、次表に示す実施例60 3~実施例604の化合物を製造した。 表22

5

実施例	R	¹H NMR (CDCl₃) δ
603	Me	1.21(3H, s), 1.38(6H, s), 3.77(1H, d, J=14.8Hz), 3.87(1H, d, J=14.8Hz), 4.05 (1H, d, J=14.3Hz), 4.15(1H, d, J=14.3Hz), 6.91(1H, d, J=7.7Hz), 7.02-7.31 (3H, m), 8.07(1H, s).
604	H	1.24(3H, s), 3.64(2H, s), 3.79(1H, d, J=14.8Hz), 3.89(1H, d, J=14.8Hz), 4.09 (1H, d, J=14.3Hz), 4.19(1H, d, J=14.3Hz), 6.93(1H, d, J=7.7Hz), 7.12(1H, d, J=7.5Hz), 7.25-7.35(2H, m), 8.07(1H, s).

実施例605

10 3,3-ジフルオロ-1-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダ ゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イルメチル)-1,3-ジヒドロインドー ル-2-オンの製造

実施例602で製造した1-[3-(2-2)-4-2] ついます 1-4ル)-2-2ドロキシー2-3 チルプロピル]-3 3-

- 15 3-ジヒドロインドールー2ーオン(903mg、2.34ミリモル)を用い、 実施例544の方法により、白色粉末の3,3-ジフルオロー1ー(2ーメチル ー6ーニトロー2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールー2ーイ ルメチル)-1,3-ジヒドロインドールー2ーオン(77mg、収率9%)を 得た。
- 20 融点 202-206℃。

対応する出発原料を用い、実施例605と同様にして、実施例606の化合物 を製造した。

実施例606

3, 3-ジメチル-1-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ 25 [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) -1, 3-ジヒドロインドール -2-オン

 $^{1}H-NMR$ (DMSO-d₆) δ ppm:

1. 25 (3H, s), 1. 37 (3H, s), 1. 78 (3H, s), 3. 9 6 (1H, d, J=15. 1Hz), 4. 00 (1H, d, J=10. 7Hz), 4. 22 (1H, d, J=15. 1Hz), 4. 57 (1H, d, J=10. 7 Hz), 7. 04-7. 17 (3H, m), 7. 24-7. 31 (1H, m), 7. 44 (1H, s).

実施例607

- 5 1-(2-クロロー4-ニトロイミダゾールー1-イル) -4-(1-エチルー1H-テトラゾールー5-イル) -2-メチルブタン-2-オールの製造 1-エチルー5-[2-(2-メチルー2-オキシラニル) エチル] -1H-テトラゾール(1.04g、5.59ミリモル) を用い、実施例541の方法により、微黄色油状物の1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)
- 10 -4-(1-エチル-1H-テトラゾール-5-イル) -2-メチルブタン-2-オール(1.15g、収率69%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 29 (3H, s), 1. 56 (3H, t, J=7. 3Hz), 2. 04-2. 22 (2H, m), 2. 91-3. 11 (2H, m), 4. 10 (2H, s),

15 4. 24 (1H, br), 4. 34 (2H. q, J=7. 3Hz), 8. 09 (1H, s).

対応する出発原料を用い、実施例607と同様にして、次表に示す実施例60 8及び実施例609の化合物を製造した。

表23

20

25

実施例	R	¹HNMR (CDCl₂) δ	収率(%)
608	н	1.26(3H, s), 2.02-2.08(2H, m), 2.96-3.17(2H, m), 3.80(1H, s), 4.04(2H, s), 7.42-7.46(2H, m), 7.60-7.62(3H, m), 8.03(1H, s).	60
609	Cl	1.26(3H, s), 2.08-2.12(2H, m), 2.96-3.15(2H, m), 3.85(1H, s), 4.07(s,2H), 7.40-7.44(2H, m), 7.56-7.61(2H, m), 8.04(1H, s).	66

実施例610

 実施例607で製造した1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-4-(1-エチル-1H-テトラゾール-5-イル)-2-メチルブタン-2-オール(1.15g、3.49ミリモル)を用い、実施例544の方法により、微黄色粉末結晶の2-[2-(1-エチル-1H-テトラゾール-5-イル)エチル]-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(68mg、収率7%)を得た。

融点 135-137℃。

対応する出発原料を用い、実施例610と同様にして、実施例611及び実施 例612の化合物を製造した。

10 実施例 6 1 1

2-メチルー6-ニトロー2- [2-(1-フェニルー1 H-テトラゾールー5 -イル)エチル]-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール 融点 158-159 \mathbb{C}_{\circ}

実施例612

融点 198-200℃。

実施例613

25

20 3-[2-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イル) エチル] <math>-5-(4-トリフルオロメチルベンジリデン) チアゾリジン-2, 4-ジオンの製造

実施例42で製造したメタンスルホン酸2-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イル)エチルエステル $(280\,\mathrm{mg}, 0.96\,\mathrm{S\,J}$ モル)及び5-(4-トリフルオロメチルベンジリデン)チアゾリジン-2, 4-ジオン($320\,\mathrm{mg}$ 、 $1.17\,\mathrm{S\,J}$ モル)を用い、

実施例537の方法により、微黄色粉末の3-[2-(2-メチル-6-ニトロー2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イル)エチル]-5-(4-トリフルオロメチルベンジリデン)チアゾリジン-2,4-ジオン

(260mg、収率58%) を得た。融点 257-258.5℃。

実施例614

5 1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)ピロリジン-2,5-ジオン (1.96g、11ミリモル)を用い、実施例541の方法により、白色粉末結晶の1-[3-(2-クロロー4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]ピロリジン-2,5-ジオン(589mg、収率16%)を得た。

 10^{-1} H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

0. 96 (3H, s), 2. 68 (4H, s), 3. 48 (2H, s), 4. 0 2 (2H, s), 5. 19 (1H, s), 8. 34 (1H, s).

対応する出発原料を用い、実施例614と同様にして、次表に示す実施例61 5及び実施例616の化合物を製造した。

15 表24

20

実施例	R	¹H NMR δ (CDCl₃)	収率 (%)
615		1.21(3H, s), 3.48(1H, s), 3.79(1H, d, J=14.6Hz), 3.90(1H, d, J=14.6Hz), 4.01(1H, d, J=14.9Hz), 4.16(1H, d, J=14.9Hz), 7.75-7.93(4H, m), 8.06(1H, s).	71
616	0.35	1.21(3H, s), 4.09(1H, d, J=14.4Hz), 4.18(1H, d, J=14.4Hz), 4.05(1H, d, J=14.3Hz), 4.15(1H, d, J=14.3Hz), 4.42(1H, d, J=14.0Hz), 4.49(1H, d, J=14.0Hz), 7.60-7.74(2H, m), 7.81-8.12 (2H, m).	55

25 実施例617

1-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピロリジン-2, <math>5-ジオンの製造

実施例 614で製造した1-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル] ピロリジン-2, <math>5-ジオ

ン $(589 \,\mathrm{mg}\,$ 、1. $86 \,\mathrm{S}\,$ リモル)を用い、実施例 $544 \,\mathrm{o}\,$ 方法により、白色 粉末結晶の1-(2- メチル-6- ニトロ-2 、3- ジヒドロイミダゾ [2 、1- - b] オキサゾール-2- イルメチル)ピロリジン-2 、5- ジオン $(232 \,\mathrm{mg}\,$ 、収率 34%)を得た。

5 融点 202.5-203.4℃。

対応する出発原料を用い、実施例617と同様にして、実施例618及び実施 例619の化合物を製造した。

実施例618

2-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダブ [2, 1-b] オキ 10 サゾール-2-イルメチル) イソインドール-1, 3-ジオン

融点 264.6-268.3℃。

実施例619

2-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) -1, 1-ジオキソ-1, 2-ジヒドロ [d] ベン

15 ゾイソチアゾールー3ーオン

融点 243-245℃(分解)。

実施例620

1- (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2- (ピリジン-3 -イル) -プロパン-2-オールの製造

20 3- (2-メチル-2-オキシラニル) ピリジン (7.4g、54.75ミリ モル) を用い、実施例541の方法により、白色粉末の1-(2-クロロー4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-(ピリジン-3-イル) -プロパン-2 -オール (3.3g、収率24%) を得た。

 $^{1}H-NMR$ (CDCl₃) δ ppm:

25 1. 65 (3H, s), 4. 19 (1H, d, J=14. 2Hz), 4. 27 (1H, d, J=14. 2Hz), 5. 82 (1H, s), 7. 24-7. 30 (1H, m), 7. 68-7. 72 (1H, m), 8. 50-8. 53 (1H, m), 8. 68 (1H, d, J=2. 3Hz).

実施例621

2-メチル-6-ニトロ-2- (ピリジン-3-イル) -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造

5 7ミリモル)を用い、実施例 5440方法により、淡茶色粉末結晶の2-メチル -6-ニトロ-2- (ピリジン-3-イル) -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール(1.8g、収率63%)を得た。

融点 212-214℃。

実施例622

10 2-メチル-6-ニトロ-2-(1-オキシピリジン-3-イル)-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造

実施例 621 で製造した 2-メチル-6-ニトロ-2-(ピリジン-3-イル) -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール(800 m g、3. 3 ミリモル)及び塩化メチレン(25 m 1)の混合物に、氷冷下に 7 m 1 m

- 15 過安息香酸(1g、4.06ミリモル)を加え、室温下にて終夜撹拌した。反応液を減圧濾過し、濾液を20%亜硫酸ナトリウム水溶液、飽和重曹水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮することにより、白色粉末の2ーメチルー6ーニトロー2ー(1ーオキシピリジン-3ーイル)-2,3ージヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサ
- 20 ゾール (330mg、39%) を得た。

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ p p m: 1. 92 (3H, s), 4. 51 (2H, s), 7. 42-7. 53 (2H, m), 8. 14 (1H, s), 8. 20-8. 24 (1H, m), 8. 42 (1H, s).

25 実施例623

1-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル)ピペリジン-4-オンの製造

1-(2-メチルオキシラニルメチル)ピペリジン-4-オン(2.2g、13 ミリモル)を用い、実施例 597 の方法により、微黄色粉末の1-(2-メチ

ルー6ーニトロー2、3ージヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル)ピペリジンー4ーオン(50mg、収率1%)を得た。

融点 124-126℃。

実施例624

4-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1-(4-トリフルオロメチ

- ルベンジル)ピペラジン-2-オン(1.6g、4.9ミリモル)を用い、実施 10 例 5 4 1 の方法により、微黄色粉末の4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミ ダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]-1-(4-トリフルオロメチルベンジル)ピペラジン-2-オン(1g、収率43%)を得た。 1 H-NMR(CDCl₃) δ ppm:
- 1. 18 (3H, s), 2. 45 (1H, d, J=13.9Hz), 2. 57

 15 (1H, d, J=13.9Hz), 2. 72-2.98 (2H, m), 3. 19

 -3. 44 (3H, m), 3. 55 (1H, d, J=16.5Hz), 4. 00

 (1H, d, J=14.3Hz), 4. 10 (1H, d, J=14.3Hz),

 4. 64 (2H, s), 7. 37 (2H, d, J=8.2Hz), 7. 61 (2H, d, J=8.2Hz), 8. 02 (1H, s).
- 20 対応する出発原料を用い、実施例624と同様にして、実施例625の化合物 を製造した。

実施例625

25 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1. 16 (3H, s), 1. 44 (9H, s), 2. 41 (1H, d, J=13. 8Hz), 2. 51 (1H, d, J=13. 8Hz), 2. 65-2. 88 (3H, m), 2. 93-3. 09 (1H, m), 3. 12-3. 28 (2H, m), 3. 99 (1H, d, J=14. 3Hz), 4. 08 (1H, d, J=14. 3

Hz), 8. 05 (1H, s).

実施例626

4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル)-1-(4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラ
 5 ジン-2-オンの製造

実施例624で製造した4-[3-(2-クロロー4-ニトロイミダゾールー1ーイル) -2-ヒドロキシー2ーメチルプロピル] -1-(4ートリフルオロメチルベンジル) ピペラジン-2ーオン(1g、2.1ミリモル) を用い、実施例544の方法により、微黄色粉末の4-(2ーメチルー6ーニトロー2,3ージヒドロイミダゾ[2,1-b] オキサゾールー2ーイルメチル) -1-(4ートリフルオロメチルベンジル) ピペラジン-2ーオン(206mg、収率22%) を得た。

融点 88-93℃。

対応する出発原料を用い、実施例626と同様にして、実施例627の化合物 15 を製造した。

実施例627

1-tert-ブチルー4-(2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ <math>[2, 1-b] オキサゾールー2-イルメチル)ピペラジンー2-オン融点 193-194℃。

20 実施例628

1-tert-ブチルー4-[2-(2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイル) エチル] ピペラジンー2ーオンの製造

実施例42で製造したメタンスルホン酸2-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イル) エチルエステル (290mg、1ミリモル)、塩酸1-tert-ブチルピペラジン-2-オン (200mg、1.28ミリモル)、トリエチルアミン(242mg、2.39 ミリモル)、ヨウ化カリウム(250mg、1.5ミリモル)及びDMF(3 m1)の混合物を70℃にて4時間撹拌した。反応液を室温に戻し、水を加え、 酢酸エチルにより2回抽出した。有機相を合わせ、2回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸マグネシムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=20/1)により精製し、白色粉末の1-tert-ブチルー4-[2-(2-メチルー6-ニトロー2,3-ジヒドロイミダブ[2,1-b]オキサゾールー2ーイル)エチル]ピペラジン-2-オン(27mg、収率8%)を得た。

融点 153-154℃。

対応する出発原料を用い、実施例628と同様にして、実施例629の化合物 を製造した。

10 実施例629

実施例630

15 1-tertーブチルー4-[3-(2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイル)プロピル]ピペラジンー2ーオンの製造

実施例39で製造したメタンスルホン酸3-(2-メチル-6-ニトロ-2,

3ージヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイル)プロピルエステ
 20 ル(300mg、0.98ミリモル)を用い、実施例628の方法により、白色粉末の1-tertーブチルー4ー[3ー(2ーメチルー6ーニトロー2,3ージヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾールー2ーイル)プロピル]ピペラジンー2ーオン(150mg、収率42%)を得た。

融点 147-149℃ (分解)。

25 実施例 6 3 1

1-(ベンズイミダゾール-1-イル)-3-(2-クロロー4-ニトロイミダ ゾール-1-イル)-2-メチルプロパン-2-オールの製造

1-(2-メチルー2-オキシラニルメチル)-1 H-ベンズイミダゾール (350 m g (35

末結晶の1-(ベンズイミダゾール-1-イル)-3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチルプロパン-2-オール(135mg、収率22%)を得た。

 1 H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

5 0. 99 (3H, s), 4. 06 (1H, d, J=14. 2Hz), 4. 23-4. 45 (3H, m), 5. 44 (1H, s), 7. 14-7. 32 (2H, m), 7. 57-7. 77 (2H, m), 8. 15 (1H, s), 8. 36 (1H, s).

対応する出発原料を用い、実施例631と同様にして、実施例632の化合物 10 を製造した。

実施例632

1 - (イミダゾールー1 - イル) - 3 - (2 - クロロー4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル) - 2 - メチルプロパン - 2 - オール

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

15 1. 19 (3H, s), 3. 86-4. 05 (3H, m), 4. 13 (1H, d, J=14. 2Hz), 6. 87 (1H, s), 6. 89 (1H, s), 7. 47 (1H, s), 8. 08 (1H, s).

実施例633

1-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキ20 サゾール-2-イルメチル)-1H-ベンズイミダゾールの製造

実施例 631で製造した 1-(ベンズイミダゾール-1-イル)-3-(2-クロロー 4-ニトロイミダゾールー1-イル) -2-メチルプロパン-2-オール $(135\,\mathrm{mg}\,\mathrm{c}\,0.4$ ミリモル)を用い、実施例 $544\,\mathrm{o}$ 方法により、白色粉末結晶の 1-(2-メチル-6-ニトロ-2、3-ジヒドロイミダゾ [2,1-

25 b] オキサゾールー2ーイルメチル) -1 Hーベンズイミダゾール (72 m g 、 収率60%) を得た。

融点 250.3-251.9℃(分解)。

対応する出発原料を用い、実施例633と同様にして、実施例634の化合物 を製造した。 実施例634

1- (2-メチル-6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) イミダゾール

融点 245.5-247.8℃。

5 実施例635

実施例12で製造した(R) -2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラ 10 ニルメチル) -4-ニトロイミダゾール(100mg、0.46ミリモル)、1, 2,3,4-テトラヒドロキノリン(122mg、0.92ミリモル)及びDM F(1m1)の混合物を80℃にて8時間撹拌した。反応液を室温に戻し、水を 加え、酢酸エチルにより2回抽出した。有機相を合わせ、2回水洗後、飽和食塩 水により洗浄し、硫酸マグネシムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧

- 15 濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=1/1)により精製し、橙色オイルの(S)-1-(2-クロロー4ーニトロイミダゾール-1-イル)-3-(3,4-ジヒドロ-2 H-キノリン-1-イル)-2-メチルプロパン-2-オール(134 mg、収率83%)を得た。 $\frac{1}{1}$ H-NMR(CDC $\frac{1}{2}$) δ p p m:
- 20 1. 24 (3H, s), 1. 94-2. 04 (2H, m), 2. 39 (1H, m), 2. 79-2. 85 (2H, m), 3. 27-3. 42 (4H, m), 6. 66-6. 72 (2H, m), 6. 97-7. 08 (2H, m), 8. 04 (1H, s).

対応する出発原料を用い、実施例635と同様にして、次表に示す実施例63 25 6~実施例638の化合物を製造した。

表25

5

10

20

実施例	R	¹H NMR δ (CDCl₃)	収率 (%)
636		1.18(3H, s), 2.51(1H, d, J=13.9Hz), 2.66(1H, d, J=13.9Hz), 2.82-2.98(4H, m), 3.76(1H, d, J=14.9Hz), 3.88(1H, d, J=14.9Hz), 4.03(2H, s), 7.00(1H, dd, J=2.3Hz, 7.7Hz), 7.06-7.20 (3H, m), 8.01(1H, s).	87
637	"(I)	1.20(3H, s), 2.55(1H, d, J=13.8Hz), 2.71(1H, d, J=13.8Hz), 3.81(1H, d, J=14.8Hz), 3.91(1H, d, J=14.8Hz), 4.05(4H, s), 7.10-7.23(4H, m), 8.00(1H, s).	93
638	N 0	1.11(3H, s), 1.67-1.78(4H, m), 2.37(1H, d, J=14.0Hz), 2.51 (1H, d, J=14.0Hz), 2.57-2.82(4H, m), 3.69(1H, s), 3.95(4H, s), 3.99(2H, s), 8.06(1H, s).	100

実施例639

(S) -1-(2-メチル-6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-15 b] オキサゾールー2ーイルメチル) -1, 2, 3, 4ーテトラヒドロキノリンの製造

実施例 635で製造した(S) -1-(2-0)ロロー4ーニトロイミダゾール -1-1(3、4ージヒドロー2Hーキノリンー1ーイル) -2-1 チルプロパン-2-1(134mg、0.38ミリモル)を用い、実施例 3 93の方法により、白色粉末の(S) -1-(2-1)(2-1) オキサゾールー6ーニトロー2、3 -1(2、1-1) オキサゾールー2ーイルメチル) -1(3、4ーテトラヒドロキノリン(64mg、54%)を得た。

融点 168-172℃。

対応する出発原料を用い、実施例639と同様にして、実施例640~実施例 25 642の化合物を製造した。

実施例640

融点 153-155.3℃。

実施例641

- (S) -2-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) -2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドー
- 5 ル

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 68 (3H, s), 3. 01 (1H, d, J=14.5Hz), 3. 24 (1H, d, J=14.5Hz), 3. 92 (1H, d, J=9.6Hz), 4. 08 (4H, s), 4. 50 (1H, d, J=9.6Hz), 7. 13-7. 2

10 1 (4H, m), 7.50 (1H, s).

実施例642

- (S) $-8-(2-\cancel{y}+\cancel{v}-6-\cancel{z}-1)-2$, $3-\cancel{y}+\cancel{v}-1$, $4-\cancel{y}+\cancel{v}-1$, 4-
- 15 融点 166.5-168.2℃。

実施例643

(2S) -メチル-6-ニトロ-2-[(2S)-(4-トリフルオロメトキシフェノキシメチル)ピロリジン-1-イルメチル]-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾールの製造

実施例12で製造した(R) -2-クロロー1-(2-メチルー2-オキシラニルメチル) -4-ニトロイミダゾール(645mg、2.97ミリモル)、(S) -2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシメチル)ピロリジン(930mg、3.56ミリモル)及びDMF(15ml)の混合物を80℃にて8時間撹拌した。この反応液に氷冷下にて水素化ナトリウム(154mg、3.862リモル)を加え、同温度下にて1時間撹拌した。反応液を氷水中に注ぎ、酢酸エチルにより2回抽出した。有機相を合わせ、2回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸マグネシムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン)により精製し、塩化メチレン/イソプロピルエーテルから再結晶し、白色粉末の(2S) -メチルー

6-ニトロ-2-[(2S)-(4-トリフルオロメトキシフェノキシメチル) ピロリジン-1-イルメチル]-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (505mg、収率41%) を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

5 1. 42-1. 52 (1H, m), 1. 59 (3H, s), 1. 61-1. 79 (2H, m), 1. 87-1. 99 (1H, m), 2. 50-2. 61 (1H, m), 3. 03-3. 17 (2H, m), 3. 06 (1H, d, J=14. 7 Hz), 3. 20 (1H, d, J=14. 7Hz), 3. 72-3. 79 (2H, m), 3. 92 (1H, dd, J=9. 2Hz, 3. 7Hz), 4. 58 (1H, d, J=9. 5Hz), 6. 80-6. 88 (2H, m), 7. 15-7. 19 (1H, m), 7. 42 (1H, s).

実施例644

4-[3-(2-)クロロー4-ニトロイミダゾールー1-イル)-2-ヒドロキシー2-メチルプロピル] ホモピペラジンー1-カルボン酸 terterm te

15 ステルの製造

2-クロロー4ーニトロー1Hーイミダゾール(8.39g、56.88ミリモル)、4ー(2ーメチルー2ーオキシラニルメチル)ホモピペラジンー1ーカルボン酸tertーブチルエステル(15.38g、56.88ミリモル)及び酢酸ナトリウム(5.13g、62.57ミリモル)の1ープロパノール(100ml)中の混合物を10時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣を塩化メチレンに溶解し、水洗後、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=5/1)により精製し、赤黄色オイルの4ー[3ー(2ークロロー4ーニトロイミダゾールー1ーイル)ー2ーヒドロキシー2ーメチルプロピル]ホモピペラジンー1ーカルボン酸tertーブチルエステル(6.25g、収率27%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 14 (3H, s), 1. 48 (9H, s), 1. 69-1. 90 (2H, m), 2. 40-2. 55 (1H, m), 2. 66 (1H, d, J=14. 1

Hz), 2. 75-2. 98 (5H, m), 3. 30-3. 59 (4H, m), 3. 96 (2H, s), 8. 06 (1H, s).

実施例645

4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキ 5 サゾール-2-イルメチル)ホモピペラジン-1-カルボン酸 tertーブチル エステルの製造

実施例 644で製造した $4-[3-(2-\rho pp-4-z) pp-4-z]$ ボモピペラジン-1-pp-4 ボン酸 1-4 ル 1-

10 実施例544の方法により、白色粉末の4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3 ージヒドロイミダブ [2,1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ホモピペラ ジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(3.07g、収率54%)を 得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

- 15 1. 47 (9H, s), 1. 59 (3H, s), 1. 68-1. 79 (2H, m), 2. 63-2. 90 (5H, m), 3. 06 (1H, d, J=15. 1 Hz), 3. 25-3. 50 (4H, m), 3. 91 (1H, d, J=9. 7 Hz), 4. 33 (1H, d, J=9. 7Hz), 7. 54 (1H, s)。 実施例646
- 20 4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキ サゾール-2-イルメチル) ホモピペラジン-1-カルボン酸ベンジルエステル 塩酸塩の製造

実施例645で製造した4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ホモピペラジン-1-カルボン酸tertーブチルエステル(250mg、0.655ミリモル)及びトリフルオロ酢酸(10ml)の混合物を室温下にて終夜撹拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣を塩化メチレン10mlに溶解し、トリエチルアミン(0.27ml, 1.96ミリモル)を加え、更にクロロギ酸ベンジル(0.19ml, 1.31ミリモル)を加え、室温下にて3時間撹拌した。反応液に水を加え、塩

化メチレンにより抽出し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、減圧濾過した。 濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メ チレン/酢酸エチル=1/1)により精製し、微黄色オイルを得た。得られたオ イルを酢酸エチルに溶解し、飽和塩酸/酢酸エチル溶液を加えることにより得ら れる結晶を濾取し、白色粉末結晶の4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジ ヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル)ホモピペラジン -1-カルボン酸ベンジルエステル塩酸塩(246 mg、収率83%)を得た。 融点 115-117 \mathbb{C} 。

実施例647

10 2-[4-(4-ビフェニリルメチル) ホモピペラジン-1-イルメチル]-2 -メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b] オキサゾールの製造

実施例645で製造した4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイ ミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ホモピペラジン-1-カ 15 ルボン酸 t e r t - ブチルエステル (346 mg、0.91ミリモル) 及びトリ

- ルホン酸 tertーノリルエスノル (3 4 0 mg、 0.9 f ミリモル) 及びドリフルオロ酢酸 (10 ml) の混合物を室温下にて終夜撹拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣を塩化メチレン10 mlに溶解し、トリエチルアミン (0.2 7 ml, 1.96 ミリモル) を加えた。減圧下にて濃縮し、残渣をメタノール10 mlに溶解した。この溶液に、4-フェニルベンズアルデヒド (496 mg、
- 20 2.72ミリモル)、シアノトリヒドロホウ酸ナトリウム(171mg、2.7 2ミリモル)、酢酸(0.17ml、2.72ミリモル)の順に加え、室温下にて終夜撹拌した。反応液を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注ぎ、塩化メチレンにより抽出し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢
- 25 酸エチル= 5 / 1) により精製し、無色粉末の2 [4 (4 ビフェニリルメチル) ホモピペラジン-1 イルメチル] 2 メチル-6 ニトロ-2, 3 ジヒドロイミダゾ [2, 1 b] オキサゾール(251mg、収率62%)を得た。

融点 138-142.2℃。

実施例648

1'-tert-ブトキシカルボニルー2, 3-ジヒドロー6-ニトロースピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2, 4'-ピペリジン] の製造

2, 4-ジニトロ-1H-イミダゾール(1.0g、6.3ミリモル)、1-5 オキサー6-アザースピロ[2,5]オクタンー6-カルボン酸tertーブチルエステル(2.0g、9.5ミリモル)及び酢酸ナトリウム(612mg、7.5ミリモル)をエタノール(7ml)中にて10時間加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、塩化メチレンを加え激しく撹拌した。反応液を塩化メチレンで抽出し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧濾過した。

融点 230-232℃。

15 実施例649

4- (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イルメチル) -4-ヒドロキシピペリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステルの製造

2-クロロ-4-ニトロ-1 H-イミダゾール(3. 1 g、2 1. 0 ミリモル)、1-オキサ-6-アザースピロ [2,5] オクタン-6-カルボン酸

- 20 tertーブチルエステル (4.4g、21.0ミリモル)及び炭酸水素ナトリウム (1.94g、23.1ミリモル)をエタノール (20m1)中にて6時間加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、水を加え、塩化メチレンで抽出後、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=100
- 25 /1) により精製して黄色油状物質の4-(2-クロロー4-ニトロイミダゾール-1-イルメチル) -4-ヒドロキシピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル(5.4g、収率72%)を得た。

 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1. 45-1.71 (5H, m), 1. 46 (9H, s), 3. 03-3.14

(2H, m), 3. 90-4. 03 (2H, m), 4. 02 (2H, s), 7. 91 (1H, s).

実施例 6 5 0

4-{2-[4-(2-クロロー4ーニトロイミダゾールー1ーイルメチル)ー
 4-ヒドロキシピペリジン-1ーイル]ー2ーオキソエチル}ピペラジン-1ーカルボン酸tertーブチルエステルの製造

 $2-\rho$ ロロー4ーニトロー1 Hーイミダゾール(1. 29 g、8. 76 ミリモル)、 $4-\{2-(1-オキサ-6-アザスピロ[2,5] オクタン-6-イル)-2-オキソエチル\} ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル(2. <math>9$ 7 g、8. 76 ミリモル)及び炭酸水素ナトリウム(8 0 9 m g、9

- 10 ル (2.97g、8.76ミリモル)及び炭酸水素ナトリウム(809mg、9.64ミリモル)をエタノール(10ml)中にて5時間加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、塩化メチレンで抽出後、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=10
- 15 0/1)により精製して黄色油状物質の4-{2-[4-(2-クロロー4-ニトロイミダゾール-1-イルメチル)-4-ヒドロキシピペリジン-1-イル]-2-オキソエチル}ピペラジン-1-カルボン酸tertーブチルエステル(2.58g、収率61%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

- 20 1. 45 (9H, s), 1. 53-1. 71 (4H, m), 2. 44 (4H, br), 2. 96-3. 04 (1H, m), 3. 10-3. 27 (2H, m), 3. 35-3. 48 (4H, m), 3. 90-3. 96 (2H, m), 4. 05 (2H, s), 4. 32-4. 37 (2H, m), 8. 04 (1H, s)。 6- (4-トリフルオロメチルフェニル} -1-オキサー6-アザースピロ
- 25 [2, 5] オクタンを用い、実施例 6 5 0 と同様にして、実施例 6 5 1 の化合物 を製造した。

実施例651

4- (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イルメチル)-1- (4-トリフルオロメチルフェニル)ピペリジン-4-オール

淡桃色粉末、収率54%

 1 H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1. 60-1. 66 (2H, m), 1. 82-1. 93 (3H, m), 3. 10 -3. 22 (2H, m), 3. 62-3. 67 (2H, m), 4. 07 (2H,

5 s), 6. 95 (2H, d, J=8.7Hz), 7. 50 (2H, d, J=8.7Hz), 7. 99 (1H, s).

実施例652

1'-tertーブトキシカルボニルー2,3-ジヒドロー6-ニトロースピロ [イミダゾ [2,1-b] オキサゾールー2,4'-ピペリジン]の製造(実施10 例648の化合物の別途合成法)

実施例 649で製造した4-(2-0ロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イルメチル) -4-ヒドロキシピペリジン-1-カルボン酸 t e r t - ブチルエステル (26.7g、74.0ミリモル) を1, 4-ジオキサン (200m1) に溶解した。この溶液に氷冷下、水素化ナトリウム (3.6g、88.8ミリモ

- 15 ル)を加え、8時間加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、残渣に氷水、塩化メチレンを加え激しく撹拌した。析出物を濾取して水、メタノールで洗浄後、減圧乾燥して一次晶として16.4gを得た。更に先の濾液を塩化メチレンで抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濾過して得られた濾液を減圧下にて濃縮し、残渣にメタノールを加え結晶化を行なって二次晶として2.7gを得た。一次晶
- 20 及び二次晶を合わせて、白色粉末の1'-tert-ブトキシカルボニルー2,
 3-ジヒドロー6-ニトロースピロ[イミダブ[2, 1-b] オキサゾールー2,
 4'-ピペリジン] (19.1g、収率79%)を得た。

融点 230-232℃。

実施例 6 5 3

25 4-[2-(2, 3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ [イミダゾ [2, 1-b]] オキサゾールー 2, 4, - ピペリジン] - 1, - イル) - 2 - オキソエチル] ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

実施例650で製造した4-{2-[4-(2-クロロー4-ニトローイミダ ゾール-1-イルメチル)-4-ヒドロキシピペリジン-1-イル]-2-オキ

融点 211.0-213.0℃。

10 対応する出発原料を用い、実施例653と同様にして、実施例654の化合物 を製造した。

実施例654

2, 3-ジヒドロ-6-ニトロ-1' -(4-トリフルオロメチルフェニル) -スピロ [イミダゾ [2 , 1-b] オキサゾール- 2 , 4' -ピペリジン]

15 白色粉末、収率79%

MS; 368 (M^+)

融点 249.2-250.1℃。

実施例 6 5 5

2,3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール20-2,4'-ピペリジン]・トリフルオロ酢酸塩の製造

実施例652で製造した1'-tert-ブトキシカルボニル-2,3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン](42g、0.13モル)を塩化メチレン(100m1)に懸濁し、氷冷下トリフルオロ酢酸(60m1)を滴下して加え、室温で終夜撹拌した。反応液を減圧下濃縮し、メタノールを加え、結晶化した。これを濾取してメタノール、酢酸エチルで洗浄して減圧乾燥し、淡茶色粉末の2,3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン]・トリフルオロ酢酸塩(43.6g、収率99%)を得た。

 $MS 224 (M^{+})$

融点 196-198℃(分解)

 $^{1}H-NMR$ (DMSO-d₆) δ ppm:

2. 06-2. 32 (4H, m), 3. 12-3. 35 (4H, m), 4. 24 (2H, s), 8. 21 (1H, s), 8. 88 (2H, bs).

5 実施例656

1'-アセチル-2, 3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ[イミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2, 4'-ピペリジン]の製造

実施例655で製造した2,3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ[イミダゾ 「2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン]トリフルオロ酢酸塩(8

- 10 5.5 mg、0.25ミリモル)を塩化メチレン(5 m1)に懸濁し、トリエチルアミン(74 μ 1)及びアセチルクロリド(20 μ 1)を加え、1時間室温で撹拌した。反応液を減圧下濃縮し、残渣にメタノール、水を加え激しく撹拌した。 析出物を濾取して水、イソプロピルエーテルで洗浄後、減圧乾燥することにより、白色粉末の1'-アセチルー2、3-ジヒドロー6-ニトロースピロ[イミダゾ
- 15 [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] (37.8mg、収率56%) を得た。

 $MS: 266 (M^{+})$

融点 232.0-234.0℃。

実施例657

20 1'-(4-トリフルオロメチルフェニルアセチル)-2,3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン]の製造

実施例 655で製造した 2、3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ [イミダゾ [2,1-b] オキサゾールー2,4-ピペリジン] トリフルオロ酢酸塩(<math>30 0 mg、0.89ミリモル)を塩化メチレン(5 m1)に懸濁し、トリエチルアミン(0.4m1、2.66ミリモル)及び(α , α , α -トリフルオロー p-トリル)酢酸クロリド(2.7m1、1.33ミリモル)を加え、1時間室温で撹拌した。反応液を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注ぎ、塩化メチレンで抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濾過した。得られた濾液を減圧下にて

5

濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=200/1)により分離精製し、塩化メチレンーイソプロピルエーテルより結晶化を行い、濾取後、減圧乾燥することにより、白色粉末の1'-(4ートリフルオロメチルフェニルアセチル)-2,3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン](143mg、収率39%)を得た。

 $MS: 410 (M^{+})$

融点 185.0-187.0℃。

実施例658

10 1'-(3,4-ジクロロフェノキシアセチル)-2,3-ジヒドロー6-ニトロースピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン]の製造

実施例655で製造した2, 3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール<math>-2, 4, -ピペリジン] トリフルオロ酢酸塩 (3

- 15 00mg、0.89ミリモル)、(3,4ージクロロフェニル)酢酸(294mg、1.24mミリモル)及びWSCD(255mg、1.24ミリモル)をDMF(5ml)中室温にて1.5時間撹拌した。反応液に水、ジエチルエーテルを加え激しく撹拌した。析出物を濾取して水、ジエチルエーテルで洗浄後、減圧乾燥し、白色粉末の1'-(3,4ージクロロフェノキシアセチル)-2,3
- 20 ージヒドロー6ーニトロースピロ [イミダゾ [2, 1 b] オキサゾールー 2, 4'ーピペリジン] (96 m g、収率 25%) を得た。

融点 218.0-220.0℃。

実施例659

25

2, 3-ジヒドロ-1'-メチル-6-ニトロースピロ[イミダゾ[2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン]の製造

実施例655で製造した2, 3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4 $^{\prime}$ $^{\prime}$ -ピペリジン] トリフルオロ酢酸塩をフリー化して得られる2, 3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4 $^{\prime}$ -ピペリジン] (250mg、1. 12ミリモ

ル)をメタノール(5 m l)に懸濁した。この懸濁液に、37%ホルムアルデヒド溶液(0.25 m l、3.35ミリモル)、シアノトリヒドロホウ酸ナトリウム(210 m g、3.35ミリモル)及び酢酸(0.19 m l、3.35ミリモル)を加え、室温で3時間撹拌した。反応液を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注ぎ、塩化メチレンで抽出した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣を塩化メチレンージイソプロピルエーテルで結晶し、白色粉末の2,3ージヒドロー1、一メチルー6ーニトロースピロ[イミダゾ[2,1-b] オキサゾールー2,4、一ピペリジン](160 m g、収率60%)を得た。

10 MS: 238 (M⁺) 融点 237.0-239.0℃ (分解)。 実施例660

1'ーベンゼンスルホニルー 2 , 3 ージヒドロー 6 ーニトロースピロ [イミダゾ [2, 1 - b] オキサゾールー 2 , 4'ーピペリジン] の製造

- 実施例655で製造した2、3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ[イミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2,4'-ピペリジン]トリフルオロ酢酸塩(197mg、0.88ミリモル)を塩化メチレン(5ml)に懸濁し、トリエチルアミン(0.36ml、2.64ミリモル)及びベンゼンスルホニルクロリド(0.28ml、2.10ミリモル)を加え、室温で30分撹拌した。反応液にジイソプロピルエーテル、水を加え激しく撹拌した。析出物を濾取し、水、ジイソプロピルエーテルで洗浄後、減圧乾燥することにより、白色粉末の1'-ベンゼンスルホニル-2、3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2、4'-ピペリジン](210mg、収率66%)を得た。MS: 364(M⁺)
- 25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δppm: 1. 99-2. 18 (4H, m), 2. 49-2. 63 (2H, m), 3. 40 -3. 54 (2H, m), 4. 10 (2H, s), 7. 65-7. 81 (5H, m), 8. 21 (1H, s).

対応する出発原料を用い、実施例660と同様にして、実施例661の化合物

を製造した。

実施例661

- 5 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ p p m: 1. 98-2. 22 (4H, m), 2. 94 (3H, s), 3. 04-3. 13 (2H, m), 3. 43-3. 51 (2H, m), 4. 16 (2H, s), 8. 17 (1H, s).

実施例662

1'ーベンジルオキシカルボニルー2,3ージヒドロー6ーニトロースピロ[イ 10 ミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2, 4'-ピペリジン] の製造 実施例655で製造した2、3ージヒドロー6ーニトロースピロ[イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'ーピペリジン] トリフルオロ酢酸塩(2 50mg、0.74ミリモル)を塩化メチレン(5ml)に懸濁し、トリエチル アミン (0.40ml、2.96ミリモル) 及びクロロギ酸ベンジル (0.32 15 m1、2.22ミリモル)を加え、室温で30分撹拌した。反応液を減圧下にて 濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノー ル=200/1) により分離精製し、塩化メチレンーイソプロピルエーテルより 結晶化を行い、濾取後、減圧乾燥することにより、白色粉末の1'ーベンジルオ キシカルボニルー2, 3ージヒドロー6ーニトロースピロ [イミダゾ [2, 1ー 20 b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] (224mg、収率84%)を得た。 融点 175.0-177.0℃。

実施例663

1' - (4-h)フルオロメチルベンジルオキシカルボニル)-2, 3-ジヒド 25 u-6-ニトロースピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4' -ピ ペリジン] の製造

実施例 655で製造した 2, 3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4 ' -ピペリジン] トリフルオロ酢酸塩(33 g、97.6ミリモル)をDMF(200ml)に懸濁し、トリエチルアミン

(20m1、0.15モル)を加えて撹拌した。そこへ4ートリフルオロメチルベンジルアルコール(25.8g、0.15モル)、1,1'ーカルボニルジイミダゾール(23.7g、0.15モル)をDMF(100m)に溶解し、3時間室温で撹拌した混合物を加え、70℃で2時間撹拌した。反応液を減圧留去して、残渣に水を加え、析出物を濾取した。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=10/1)により分離精製し、酢酸エチルーイソプロピルエーテルから再結晶を行い、濾取後、減圧乾燥することにより、白色粉末の1'ー(4ートリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル)ー2,3ージヒドロー6ーニトロースピロ[イミダゾ[2,1ーb]オキサゾールー2,4'ーピペリジン](37.2g、収率90%)を得た。

融点 189-190℃。

対応する出発原料を用い、実施例663と同様にして、実施例664及び実施 例665の化合物を製造した。

実施例 6 6 4

15 1'-[(4-トリフルオロメトキシ) ベンジルオキシカルボニル]-2,3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン]

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 80-1. 93 (2H, m), 2. 13-2. 19 (2H, m), 3. 32

20 -3. 42 (2H, m), 4. 00-4. 20 (2H, m), 4. 03 (2H, s), 5. 14 (2H, s), 7. 20-7. 23 (2H, m), 7. 38-7. 46 (2H, m), 7. 54 (1H, s).

実施例665

1'-(4-ホルミルアミノベンジルオキシカルボニル)-2,3-ジヒドロー 25 6-ニトロースピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリ ジン]

 1 H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

1. 85-2. 10 (4H, m), 3. 15-3. 40 (2H, m), 3. 65
-3. 85 (2H, m), 4. 16 (2H, s), 5. 03 (2H, s), 7.

33 (2H, d, J=8.5Hz), 7.58 (2H, d, J=8.5Hz), 8.15 (1H, s), 8.27 (1H, s).

実施例667

2、3ージヒドロー6ーニトロースピロ [イミダゾ [2、1ーb] オキサゾール 5 -2、4'ーピペリジン] -1'ーカルボン酸フェニルアミドの製造 実施例655で製造した2、3ージヒドロー6ーニトロースピロ [イミダゾ [2、1ーb] オキサゾールー2、4'ーピペリジン] トリフルオロ酢酸塩(100mg、0.30ミリモル)をDMF5m1に懸濁し、トリエチルアミン(43μ1、0.31ミリモル)及びフェニルイソシアネート(34μ1、0.31 ミリモル)を加え、室温で30分撹拌した。反応液に水を加え撹拌して、析出物を濾取した。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=100/1)により分離精製し、酢酸エチルより再結晶を行い、濾取後減圧乾燥することにより、白色粉末の2、3ージヒドロー6ーニトロースピロ

15 ボン酸フェニルアミド (90mg、収率88%) を得た。

 $MS; 343 (M^+)$

融点 229-232℃(分解)。

4-イソシアン酸ピリジン又はイソシアン酸ベンジルを用い、実施例667と 同様にして、実施例668及び実施例669の化合物を製造した。

[イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'ーピペリジン] -1'ーカル

20 実施例668

2, 3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール -2, 4' -ピペリジン] -1' -カルボン酸 4-ピリジンアミド 融点 217-219 \mathbb{C} 。

実施例669

25 2, 3-ジヒドロー6ーニトロースピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2, 4'ーピペリジン]ー1'ーカルボン酸ベンジルアミド
 融点 244-247℃(分解)。

実施例670

4-(2, 3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ[イミダゾ[2, 1-b]オキサ

5

ゾール-2, 4, -ピペリジン] -1, -イルカルボニル) ピペラジン-1-カルボン酸 t e r t - ブチルエステルの製造

トリホスゲン (227 m g、0.77ミリモル)をトルエン10 m l に溶解し 氷冷した。この溶液に、ピペラジン-1-カルボン酸 t e r t -ブチルエステル (425 m g、2.28ミリモル)及びジイソプロピルエチルアミン (0.4

m1、2. 28ミリモル)を加え、1時間撹拌した後、続いて実施例655で製造した2,3ージヒドロー6ーニトロースピロ [イミダゾ [2,1-b] オキサゾールー2,4'ーピペリジン]トリフルオロ酢酸塩(700mg、2.07ミリモル)を加え、室温で1時間撹拌し、更に1時間加熱還流した。反応液を水に

10 注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/アセトン=10/1)により精製した後、塩化メチレンージイソプロピルエーテルで結晶化して、白色粉末の4ー(2,3-ジヒドロー6-ニトロースピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾー

融点 260.0-265.0℃(分解)

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 47 (9H, s), 1. 90-2. 02 (2H, m), 2. 10-2. 16

20 (2H, m), 3. 23-3. 47 (10H, m), 3. 60-3. 66 (2H, m), 3. 96 (2H, s), 7. 54 (1H, s).

ピペラジン-1 - カルボン酸 4 - トリフルオロメチルベンジルエステル又は 1 - (4 - トリフルオロメチルベンジル) ピペラジンを用い、実施例 6 7 0 と同様にして、実施例 6 7 1 \sim 実施例 6 7 2 0 化合物を製造した。

25 実施例671

4-(2,3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ [イミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2,4'-ピペリジン]-1'-イルカルボニル) ピペラジン-1-カルボン酸4-トリフルオロメチルベンジルエステル

融点 221-223℃。

実施例672

1-(2,3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'ーピペリジン]-1'ーイルカルボニル)-4-(4ートリフルオロメチルベンジル) ピペラジン

5 融点 226-230℃(分解)。

実施例673

2, 3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4' -ピペリジン] -1' -カルボン酸4-(ジメチルアミノ)フェニルアミドの製造

実施例655で製造した2、3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ [イミダゾ [2,1-b] オキサゾールー2、4'ーピペリジン] トリフルオロ酢酸塩(200mg、0.59ミリモル)をDMF(5ml)に懸濁し、トリエチルアミン(0.1ml、0.72ミリモル)を加え撹拌した。そこへN、Nージメチルーpーフェニレンジアミン(132mg、0.98ミリモル)及び1、1'ーカル ボニルジイミダゾール(82.7mg、1.02ミリモル)をDMF(5ml)に溶解し3時間室温で撹拌した混合物を加え、室温で30分撹拌した。反応液に水を加え、撹拌して、析出物を濾取した。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=100/1)により分離精製し、酢酸エチルより結晶化を行い、濾取後、減圧乾燥することにより、白色粉末の2、3-ジ20ヒドロ-6-ニトロースピロ[イミダゾ[2,1-b] オキサゾールー2、4'

20 ヒドロー6ーニトロースピロ【イミタソ【2, 1ーb】オキサソールー2, 4 ーピペリジン】-1'ーカルボン酸4-(ジメチルアミノ)フェニルアミド(181mg、収率79%)を得た。

 $MS 386 (M^{+})$

融点 244-247℃(分解)。

25 4-トリフルオロメチルベンジルアミンまたは4-トリフルオロメトキシベン ジルアミンを用い、実施例673と同様にして、実施例674及び実施例675 の化合物を製造した。

実施例 6 7 4

2, 3-ジヒドロー6-ニトロースピロ[イミダゾ[2, 1-b] オキサゾール

-2, 4'-ピペリジン]-1'-カルボン酸4-トリフルオロメチルベンジルアミド

融点 215-217℃。

実施例675

5 2、3-ジヒドロー6ーニトロースピロ [イミダゾ [2、1ーb] オキサゾール ー2、4、一ピペリジン] ー1、一カルボン酸4ートリフルオロメトキシベンジ ルアミド

融点 223-225℃。

実施例676

2、3-ジヒドロー6-ニトロースピロ[イミダゾ[2、1-b] オキサゾールー2、4'ーピペリジン]ー1'ーカルボチオ酸4ークロロフェニルアミドの製造

実施例655で製造した2, 3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4 ' -ピペリジン] トリフルオロ酢酸塩(2

- 15 00mg、0.59ミリモル)をDMF(5ml)に懸濁し、トリエチルアミン(0.24ml、1.77ミリモル)及びイソチオシアン酸4ークロロフェニル(200mg、1.18ミリモル)を加え、室温で30分撹拌した。反応液に水を加え撹拌して、析出物を濾取した。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=100/1)により分離精製し、塩化メチレン
- 20 ージイソプロピルエーテルで結晶化を行い、濾取後、減圧乾燥することにより、 白色粉末の2,3ージヒドロー6ーニトロースピロ [イミダゾ [2,1-b] オ キサゾールー2,4'ーピペリジン]ー1'ーチオカルボン酸4ークロロフェニ ルアミド(222mg、収率87%)を得た。

 $^{1}H-NMR$ (DMSO-d₆) δ ppm:

25 2. 02-2. 19 (4H, m), 3. 59-3. 69 (2H, m), 4. 19 (2H, s), 4. 40-4. 54 (2H, m), 7. 30-7. 37 (4H, m), 8. 18 (1H, s), 9. 48 (1H, s).

実施例677

4-[(2, 3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ[イミダゾ[2, 1-b]オキ

サゾールー 2, 4'ーピペリジン]) -1'ーイルカルボニル] アミノ安息香酸の製造

4-[(2,3-ジヒドロー6-ニトロースピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾールー2,4'ーピペリジン])ー1'ーイルカルボニル]アミノ安息香 5 酸tertーブチルエステル(150mg、0.68ミリモル)を塩化メチレン(1ml)に溶解し、トリフルオロ酢酸(5ml)を加え、室温にて終夜撹拌した。反応液を減圧下濃縮し、残渣にメタノールー酢酸エチルを加えて結晶化を行い、白色粉末の4-[(2,3-ジヒドロー6-ニトロースピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾールー2,4'ーピペリジン])ー1'ーイルカルボニル]ア 10 ミノ安息香酸(59mg、収率45%)を得た。

融点 >300℃

 1 H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

1. 92-2. 12 (4H, m), 3. 32-3. 39 (2H, m), 3. 86-3. 95 (2H, m), 4. 17 (2H, s), 7. 45 (2H, d, J=8.

15 8Hz), 7.82 (2H, d, J=8.8Hz), 8.17 (1H, s), 8. 97 (1H, s), 12.54 (1H, s).

実施例678

2-[(2, 3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2, 4'ーピペリジン])-1'-イル] ベンゾチアゾールの製造

- 実施例655で製造した2,3ージヒドロー6ーニトロースピロ[イミダゾ [2,1-b]オキサゾールー2,4'ーピペリジン]トリフルオロ酢酸塩(84mg、0.25ミリモル)をDMF(3ml)に懸濁し、トリエチルアミン(76μl、0.55ミリモル)及び2ークロロベンズチアゾール(40μl、0.30ミリモル)を加え、80℃で1時間撹拌した。反応液を減圧留去して、
- 25 残渣に水を加え、析出物を濾取した。これを塩化メチレンーメタノールで結晶化を行い、濾取後減圧乾燥することにより、白色粉末の2ー [(2,3-ジヒドロー6ーニトロースピロ [イミダゾ [2,1-b] オキサゾールー2,4'ーピペリジン])ー1'ーイル]ベンゾチアゾール(55mg、収率62%)を得た。MS: 357 (M^+)

 $^{1}H-NMR$ (DMSO-d₆) δ ppm:

2. 05-2. 23 (4H, m), 3. 52-3. 63 (2H, m), 3. 89 -3. 97 (2H, m), 4. 18 (2H, s), 7. 05-7. 12 (1H,

m), 7. 26-7. 32(1H, m), 7. 46-7. 49(1H, m), 7.

5 76-7.80 (1H, m), 8.18 (1H, s).

5-クロロー1-フェニルー1H-テトラゾールを用い、実施例678と同様 にして、実施例679の化合物を製造した。

実施例679

5-[(2,3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ[イミダゾ[2,1-b]オキ 10 サゾール-2,4'-ピペリジン])-1'-イル}-1-フェニル-1H-テ トラゾール

 $^{1}H-NMR$ (DMSO-d₆) δ ppm:

2. 05-2. 09 (4H, m), 3. 24-3. 40 (4H, m), 4. 14 (2H, s), 7. 59-7. 72 (5H, m), 8. 15 (1H, s).

15 実施例680

4-(2,3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ [イミダゾ [2,1-b] オキサ ゾール-2,4'-ピペリジン] <math>-1'ーイルアセチル) ピペラジン-1-カル ボン酸 ter t-ブチルエステルの製造

実施例655で製造した2,3ージヒドロー6ーニトロースピロ [イミダゾ 20 [2,1-b] オキサゾールー2,4'ーピペリジン] トリフルオロ酢酸塩(7 00mg、2.07ミリモル)をDMF20m1に懸濁し、4ー(クロロアセチル)ピペラジンー1ーカルボン酸tertーブチルエステル(599mg、2.2 8ミリモル)、ジイソプロピルエチルアミン(0.8ml、4.57ミリモル)及びヨウ化ナトリウム(310mg、2.07ミリモル)を加え、100℃で3時間撹拌した。反応液を室温に戻し、酢酸エチル、水を加え激しく撹拌した。析出物を濾取して水、酢酸エチルで洗浄後、減圧乾燥することにより、白色粉末の4ー(2,3ージヒドロー6ーニトロースピロ[イミダゾ[2,1-b] オキサゾールー2,4'ーピペリジン]ー1'ーイルアセチル)ピペラジンー1ーカルボン酸tertーブチルエステル(688mg、収率74%)を得た。

融点 >300℃

 $^{1}H-NMR$ (DMSO-d₆) δ ppm:

1. 41 (9H, s), 1. 95-2. 01 (4H, m), 2. 43-2. 64 (4H, m), 3. 21 (2H, s), 3. 26-3. 42 (6H, m), 3.

5 50-3.52(2H, m), 4.12(2H, s), 8.14(1H, s)。
 2-クロローN-(4-トリフルオロメチルフェニル)アセタミド又は3-(3-クロロプロピル)-3H-ベンゾオキサゾール-2-オンを用い、実施例680と同様にして、実施例681及び実施例682の化合物を製造した。
 実施例681

10 (2,3-ジヒドロー6-ニトロースピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾールー2,4'ーピペリジン])ー1'ーイル酢酸(4ートリフルオロメチルフェニル)アミド

融点273-275℃(分解)。

実施例682

15 3-[3-(2, 3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ[イミダゾ[2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン])-1'-イル]プロピル-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン

融点 190-192℃。

実施例683

20 4-[2-(2, 3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ[イミダゾ[2, 1-b] オキサゾールー2, 4'ーピペリジン])ー1'ーイルエチル]ピペラジンー1ーカルボン酸tertーブチルエステルの製造

25 00mg、0.59ミリモル)をDMF5mlに懸濁し、4-(2-クロロエチル)ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(150mg、0.60ミリモル)、トリエチルアミン(0.25ml、1.79ミリモル)及びヨウ化ナトリウム(108mg、0.72ミリモル)を加え、50℃で5時間撹拌した。反応液を室温に戻し、酢酸エチル、水を加え激しく撹拌した。析出物を濾

取して水、酢酸エチルで洗浄後、減圧乾燥することにより、白色粉末の4-[2-(2,3-i)] ではいった 3-i にいった 1-i にはいった 1-i にいった 1-i にい

5 融点 214-215℃。

実施例684

4-[2-(2,3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ[イミダゾ[2,1-b] オキサゾールー2,4'ーピペリジン]ー1'ーイル)ー2ーオキソエチル]ピペラジンー1-カルボン酸4-トリフルオロメチルベンジルエステルの製造

実施例653で製造した4-[2-(2, 3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ 10 [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2, 4'ーピペリジン] -1'ーイ ル) -2-オキソエチル] ピペラジン-1-カルボン酸 t e r t ーブチルエステ ル (300mg、0.67ミリモル) を塩化メチレン5m1に溶解し、トリフル オロ酢酸5mlを加え、室温で6時間撹拌した。反応液を減圧下濃縮し、塩化メ チレン及びトリエチルアミンを1mlずつ加えた。反応液を室温で5分撹拌した 15 後、減圧下濃縮し、残渣をDMF15mlに溶解した。そこへ4ートリフルオロ メチルベンジルアルコール (293mg、1.67ミリモル)及び1,1'ーカ ルボニルジイミダゾール(270mg、1.67ミリモル)をDMF5mlに溶 解し3時間室温で撹拌した混合物を加え、室温で終夜撹拌した。反応液を水に注 ぎ、酢酸エチルで抽出後、有機相を飽和食塩水で洗浄した。これを硫酸マグネシ 20 ウムで乾燥後、減圧濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリ カゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=200/1)に より分離精製し、塩化メチレンーイソプロピルエーテルより結晶化を行い、濾取 後、減圧乾燥することにより、微桃色粉末の4-[2-(2,3-ジヒドロー6 ーニトロースピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2, 4'ーピペリジ 25 ン] -1', -イル) -2-オキソエチル] ピペラジン-1-カルボン酸4-トリ

フルオロメチルベンジルエステル (324mg、収率88%)を得た。

MS 553 (M+H) ⁺ 融点 139.0-141.0℃。 対応する出発原料を用い、実施例684と同様にして、実施例685の化合物を製造した。

実施例685

実施例683で製造した4-[2-(2, 3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'ーピペリジン])-1'ーイ
 10 ルエチル] ピペラジン-1-カルボン酸 tertーブチルエステルを用い、実施 例684と同様にして、実施例686~実施例689の化合物を製造した。

実施例686

4-[2-(2, 3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2, 4'ーピペリジン])ー1'ーイルエチル] ピペラジンー1

融点 178-179℃。

- カルボン酸 4 - クロロベンジルエステル

実施例687

15

20

25

4-[2-(2,3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ[イミダゾ[2,1-b] オキサゾール-2,4'-ピペリジン])-1'-イルエチル]ピペラジン-1-カルボン酸4-トリフルオロメチルベンジルエステル

融点 174-175℃。

実施例688

4-[2-(2,3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン])-1'-イルエチル]ピペラジン<math>-1-カルボン酸4-トリフルオロメトキシベンジルエステル

融点 176-177℃。

実施例689

 -カルボン酸4-ビフェニリルメチルエステル

¹H-NMR (CDCl₃) δppm:

1. 90-2. 05 (2H, m), 2. 15-2. 20 (2H, m), 2. 40
-2. 80 (12H, m), 3. 45-3. 60 (4H, m), 3. 99 (2H, s), 5. 17 (2H, s), 7. 31-7. 62 (10H, m).

実施例 680で製造した 4-(2, 3-i)ビドロー6-iニトロースピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー 2, 4 ' -ピペリジン] -1 ' -イルアセチル) ピペラジン -1 -カルボン酸 +1 +1 を用い、実施例 +1 を見様にして、実施例 +1 のの化合物を製造した。

10 実施例690

5

4-(2,3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ [イミダゾ [2,1-b] オキサ ゾール-2,4'-ピペリジン]-1'-イルアセチル) ピペラジン<math>-1-カルボン酸4-(トリフルオロメチル) ベンジルエステル

融点 137-139℃。

15 実施例691

1-(2,3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ [イミダゾ [2,1-b] オキサ ゾール-2,4'-ピペリジン] <math>-1'-イル) -2-[4-(4-トリフルオ ロメチルベンジル) ピペラジン-1-イル] エタノンの製造

実施例653で製造した4-[2-(2, 3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ 20 [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2, 4'ーピペリジン]ー1'ーイル)ー2ーオキソエチル]ピペラジンー1ーカルボン酸tertーブチルエステル(300mg、0.67ミリモル)を塩化メチレン5mlに溶解し、トリフルオロ酢酸10mlを加え、室温で6時間撹拌した。反応液を減圧下濃縮し、塩化メチレン及びトリエチルアミンを1mlずつ加えた。室温で5分撹拌した後、減25 圧下濃縮した。残渣をメタノール10mlに溶解し、氷冷下4ートリフルオロメチルベンズアルデヒド(0.23ml、1.67ミリモル)、シアノトリヒドロホウ酸ナトリウム(105mg、1.67ミリモル)及び酢酸0.1mlを加え、室温まで昇温し、終夜撹拌した。次いでこれに飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び塩化メチレンを加え撹拌した。有機相を硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濾過

した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=50/1)により分離精製し、塩化メチレンージイソプロピルエーテルより結晶化を行い、濾取後減圧乾燥することにより、白色粉末の1-(2,3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ[イミダゾ[2,

5 1-b] オキサゾール-2, 4'ーピペリジン]-1'ーイル)-2-[4-(4-トリフルオロメチルベンジル)ピペラジン-1ーイル]エタノン(226mg、収率67%)を得た。

 $MS: 508 (M^{+})$

融点 145-147℃。

10 対応する出発原料を用い、実施例691と同様にして、実施例692の化合物 を製造した。

実施例692

1-(2, 3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサ ゾールー2, 4'-ピペリジン] <math>-1'-イル)-2-[(4-フェニルベンジ

15 ル) ピペラジンー1ーイル] エタノン

融点187-188℃。

実施例 680で製造した 4-(2,3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ [イミダゾ [2,1-b] オキサゾールー 2,4'-ピペリジン] -1'-イルアセチル)ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルを用い、実施例 69

20 1と同様にして、実施例693及び実施例694の化合物を製造した。

実施例693

 $1-(2, 3-\overline{y}$ ヒドロ-6-ニトロースピロ [イミダブ [2, 1-b] オキサブール-2, 4 ' -ピペリジン] -1 ' -イルアセチル) -4-(4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン

25 融点 195-197℃(分解)。

実施例694

 $1-(2, 3-\overline{y}$ ヒドロ-6-ニトロ-スピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4 ' -ピペリジン] -1 ' -イルアセチル) -4-(4-フェニルベンジル) ピペラジン

15

融点 226-227℃(分解)。

実施例695

4-[(2,3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ [イミダゾ [2,1-b] オキサゾールー2,4'-ピペリジン]-1'-イル)-2-オキソエチル] ピペラジン-1-カルボン酸 <math>(4-トリフルオロメチルフェニル) アミドの製造

実施例653で製造した4-[2-(2,3-ジヒドロー6-ニトロースピロ [イミダゾ [2,1-b] オキサゾールー2,4'ーピペリジン]ー1'ーイル)ー2ーオキソエチル]ピペラジンー1ーカルボン酸tertーブチルエステル(300mg、0.67ミリモル)を塩化メチレン5mlに溶解し、トリフルオロ酢酸10mlを加え、室温で4時間撹拌した。反応液を減圧下濃縮し、塩化メチレン及びトリエチルアミンを1mlずつ加えた。室温で5分撹拌した後、減圧下濃縮し、残渣をDMF10mlに溶解した。そこへ4ーアミノベンゾトリフルオリド(0.17ml、1.33ミリモル)及び1,1'ーカルボニルジイミダゾール(220mg、1.33ミリモル)をDMF5mlに溶解し3時間室温で撹拌した混合物を加え、室温で2時間撹拌した。反応液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出後、有機相を飽和食塩水で洗浄した。これを硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=200/1)により分離精製し、

塩化メチレンーイソプロピルエーテルより結晶化を行い、濾取後、減圧乾燥する 20 ことにより、白色粉末の4-[(2,3-ジヒドロー6-ニトロースピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾールー2,4'ーピペリジン]ー1'ーイル)ー2ーオキソエチル]ピペラジンー1ーカルボン酸(4ートリフルオロメチルフェニル)アミド(213mg、収率59%)を得た。

融点 153.0-155.0℃。

25 実施例696

 $2-\{4-[2-(2,3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ[イミダゾ[2,1-b]] オキサゾールー2,4'-ピペリジン]-1'-イル)-2-オキソエチル]ピペラジン-1-イル]-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)アセトアミドの製造$

実施例653で製造した4-[2-(2,3-ジヒドロー6-ニトロースピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2, 4'ーピペリジン] ー1'ーイル) -2-オキソエチル]ピペラジン-1-カルボン酸tertーブチルエステ ル (300mg、0.67ミリモル) を塩化メチレン5mlに溶解し、トリフル オロ酢酸10mlを加え、室温で6時間撹拌した。反応液を減圧下濃縮し、残渣 に塩化メチレン及びトリエチルアミンを1m1ずつ加えた。室温で5分撹拌した 後、減圧下濃縮した。残渣をDMF10m1に溶解し、2-ブロモ-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)アセタミド (207mg、0.73ミリモル)及 びトリエチルアミン(0.28m1、2.0ミリモル)加え、100℃で2時間 撹拌した。反応液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出後、有機相を飽和食塩水で洗浄 10 した。これを硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濾過し、得られた濾液を減圧下に て濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタ ノール=100/1)により分離精製し、塩化メチレンージイソプロピルエーテ ルより結晶化を行い、濾取後減圧乾燥することにより、白色粉末の2ー{4ー 「2- (2, 3-ジヒドロー6-ニトロースピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキ 15 サゾール-2,4'-ピペリジン]-1'-イル)-2-オキソエチル]ピペラ ジンー1ーイル}-N-「4-(トリフルオロメチル)フェニル]アセトアミド (275mg、収率75%) 得た。

 $MS 552 (M+1)^{+}$

20 融点 133.0-135.0℃。

実施例697

- 2-[4-(ベンゾオキサゾール-2-イル) ピペラジン-1-イル] -1- (2, 3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ[イミダゾ[2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] -1'-イル) エタノンの製造
- 25 実施例653で製造した4-[2-(2, 3-ジヒドロー6-ニトロースピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2, 4'ーピペリジン] ー1'ーイ ル)ー2ーオキソエチル] ピペラジンー1ーカルボン酸 tertーブチルエステル(227mg、0.50ミリモル)を塩化メチレン5mlに溶解し、トリフル オロ酢酸5mlを加え、室温で4時間撹拌した。反応液を減圧下濃縮し、残渣に

塩化メチレン及びトリエチルアミンを $1 \, \mathrm{m} \, 1 \, \mathrm{f}$ つ加えた。室温にて $5 \, \mathrm{分撹拌}$ した後、減圧下濃縮した。残渣を $\mathrm{DMF} \, 5 \, \mathrm{m} \, 1 \, \mathrm{tr}$ に溶解し、トリエチルアミン($0.21 \, \mathrm{m} \, 1$ 、 $1.52 \, \mathrm{s}$ リモル)及び $2- \mathrm{d} \, \mathrm{p} \, \mathrm{p}$ で、反応液に水を加え、塩化 $0.76 \, \mathrm{s}$ リモル)を加え、 $80 \, \mathrm{CC} \, \mathrm{c}$ 時間撹拌した。反応液に水を加え、塩化メチレンで抽出した。有機相を硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣を塩化メチレン一酢酸エチルより結晶化を行い、濾取後減圧乾燥することにより、淡黄色粉末の $2-[4-(ベンゾオキサゾール-2-イル) \, \mathrm{l} \, \mathrm{l} \, \mathrm{l} \, \mathrm{l} \, \mathrm{l}$ グラジン $-1- \mathrm{l} \, \mathrm{l} \, \mathrm{l} \, \mathrm{l} \, \mathrm{l}$ グラジン $-1- \mathrm{l} \, \mathrm{l} \, \mathrm{l} \, \mathrm{l} \, \mathrm{l}$ クートロースピロ $-1 \, \mathrm{l} \, \mathrm{l} \, \mathrm{l} \, \mathrm{l} \, \mathrm{l} \, \mathrm{l}$ で、 $-1 \, \mathrm{l} \, \mathrm{l} \, \mathrm{l} \, \mathrm{l} \, \mathrm{l} \, \mathrm{l} \, \mathrm{l}$ で、 $-1 \, \mathrm{l} \, \mathrm{l} \, \mathrm{l} \, \mathrm{l} \, \mathrm{l} \, \mathrm{l}$ で、 $-1 \, \mathrm{l} \, \mathrm{l} \, \mathrm{l} \, \mathrm{l} \, \mathrm{l} \, \mathrm{l} \, \mathrm{l}$ で、 $-1 \, \mathrm{l} \, \mathrm{l} \, \mathrm{l} \, \mathrm{l} \, \mathrm{l} \, \mathrm{l} \, \mathrm{l}$ で、 $-1 \, \mathrm{l} \, \mathrm{l} \, \mathrm{l} \, \mathrm{l} \, \mathrm{l} \, \mathrm{l} \, \mathrm{l}$ で、 $-1 \, \mathrm{l} \, \mathrm{l} \, \mathrm{l} \, \mathrm{l} \, \mathrm{l} \, \mathrm{l} \, \mathrm{l}$ で、 $-1 \, \mathrm{l} \, \mathrm{l}$ で、 $-1 \, \mathrm{l} \, \mathrm{l}$ で、 $-1 \, \mathrm{l} \, \mathrm{l}$ で、 $-1 \, \mathrm{l} \,$

 $MS 467 (M^{+})$

融点 260.0-263.0℃(分解)。

適当な出発原料を用い、上記実施例1-697と同様の方法により製造した化 合物を下記表26-77に示す。

表26

5 mp(°C) **R7** 実施例 R1 R2R3 R4 R5R6 ·H -H -H -H -CH₃ ·H -H 193-195 698 -CO₂C₂H₅ ·H ·H 195-197.5 699 -H -H ·H -H 189-190 -H ·H -OCH₃ ·H ·H 700 ·H ·H 182-183 -H ·H -Cl -Cl -H 701 ·H -H -H ·H -H 185-186 702 -H ·H -H ·H -OCH₃ -H -H -H 177.5 - 179 -CH₃ ·H ·H 703 -H -H -H -F -H ·H 194-196 704 -CH₃ -H 145-147 -H ·H -H -H ·CH₃ 705 -CH_a ·H -H ·H ·H -CI -H 190.5-192 -CH₃ 706 -CH₃ ·H -Cl 163-164 707 -H -H ·H -H OCH₃ 10 ·H ·H -H ·H 177-180 -H 708 -CH₃ ·CH₃ -H -H -CF₃ -H 182-183.5 709 -H ·H -H 179-182 -CH₃ -OCH₃ -OCH₃ 710 $\cdot H$ ·H -OCH₃ -F 142 - 144 -CH₃ ·H ·H ·H -H ·H 711 197 - 199 ·H -CH₃ -H -H -H -Br ·H 712 234 - 235 ·H -CONH₂ dec ·H -H ·H ·H 713 -CH₃ -CO₂C₂H₅ -H ·H 151 - 152 -CH₃ ·H ·H -H 714 196 - 199 ·CH₃ -H -H -H -COCH₃ -H ·H 715 ·H 218 - 220 -H -H ·SO₂NH₂ -H dec ·H 716 -CH₃ 112 - 114 -CH₃ ·H -H ·H ·H -CO₂C₂H₅ -H 717 132 - 134 -H -H CO₂C₂H₅ ·H ·H 718 ·CH_s ٠H -CH₃ ·H 132 - 133 -CH₃ -H -H -Br $-\mathbf{H}$ 719 15 198.5 - 200 ·CH₃ -H ·H 720 -H -H -H -CF₃ 163.5 · 164.8 129 · 130 -OCF₃ ·H ·H ·CH₃ -H -H $\cdot \mathbf{H}$ 721 -CH₃ -CF₃ -OCF₃ -CH_s -H ·H -H ·H 722 -H ·H 138 - 140 -H ·H 723 ·CH₃ -CH_a Morpholino--H ٠H 223-225 724 ·CH₃ -H -H \mathbf{H} -H · -H 134-135 Morpholino-725 -CH_a -H -H ·H C₆H₁₃NHCO--H -H 197-198 726 ·CH₃ -H ·H ·H

表27

$$0_2N \qquad N \qquad N \qquad N \qquad N \qquad N \qquad R2$$

-			D :	TO.	mp(°C) or 1H NMR
_	実施例	n	R1	R2	
5	727	1	-H	$-CH_2Ph$	143.5-145
J	728	1	-H	$-cyclo-C_6H_{11}$	187-188.5
•	729	1	-CH ₃		141 - 142
	730	1	-CH ₃	$-(CH_2)_2Ph$	124 - 127
	731	1	-CH ₃	-cyclo- C_6H_{11}	176 - 178
	732	1	-CH ₃	-4-PYRIDYL	151 – 153 (dec)
	733	1	·CH ₃	$-CH(CH_3)_2$	163 - 165
	734	1	-CH ₈	$-CH_2CO_2C_2H_5$	142 - 143
	735	1	·CH ₃	$-C_0H_{13}$	129 - 130
	736	1	-CH ₃	-(CH2)2CO2C2H5	94 - 96
		1	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ Cl	DMSO-d _c , 1.59(3H, s), 3.22-3.33(2H, m),
			•		3.57(2H, t, J=6.0Hz), 4.07(2H, dd, J=11.1Hz,
10	737				27.6Hz), 4.27(2H, dd, J=7.6Hz, 9.9Hz),
10					6.47-6.59(1H, m), 8.13(1H, s)
		1	-H	$-C_8H_{17}$	DMSO-d6, 0.85(3H, t, J=6.9Hz), 1.00-
				·	1.45(12H, m), 2.90-2.98(2H, m), 4.06(1H,
	738				dd, J=6.8Hz, 10.8Hz), 4.25-4.46(3H, m),
	,,,,				5.48-5.66(1H, m), 7.28(1H, t, J=5.6Hz),
					8.13(1H, s)
	739	. 2	- H	C ₈ H ₁₇ -	86-88
		_		·	131-133
	740	2	-CH ₃		
	741	2	-CH ₃	PhCH ₂ -	127-127.5
	742	2	·CH ₃	PhCH ₂ CH ₂ -	124-125
15	1720				

表28

	実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	mp(°C)
	743	-CH ₃	-CH ₉	-H	·H	-H	-Cl	·H	103 - 104
	744	-CH ₃	-CH ₂ Ph	-H	-H	-Cl	·H	$\cdot \mathbf{H}$	168 - 169
	745	-CH ₃	$-C_6H_{13}$	-H	-H	-Cl	$^{ ext{-}}\mathbf{H}$	$\cdot_{\rm H}$	98 - 100
	746	-CH ₃	-CH ₃	-H	\mathbf{H}	$\cdot \mathbf{Br}$	$^{ ext{-}}\mathbf{H}$	-H	147 - 150
	747	$-CH_3$	-CH ₃	-H	-H	-CF ₃	-H	-H	140 - 141
0.5	748	$-CH_3$	$-CH_3$	-H	$\cdot H$	- F	·H	\cdot H	111 - 113
25	749	-CH _a	$-C_4H_9$	-H	·H	-Cl	·H	-H	114 - 116
	750	-CH ₃	$-C_2H_5$	·H	$\cdot \mathbf{H}$	-C1	-H	-H	87 - 89
	751	-CH ₃	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-H	-C1	-H	-H	161 - 165
	752	-CH ₃	4-ClPhCH ₂ -	- H	-H	-Cl	-H	-H	175 - 178
		<u> </u>							

表29

R2 mp(°C) 実施例 R1 5 -CH₃ 4-CF₃OPh- 165 - 166 753 -CH₃ 4-CH₃OPh- 155 - 157 -CH₃ 4-ClPh- 157 - 158 -CH₃ 3-CF₃Ph- 100 - 101 **754 755 756** -CH₃ 4-BrPh-757 168 - 170 151 - 154 -CH₃ 4-FPh-**758**

10 表30

	実施例	R1	R2	mp(°C)
	759	-CH ₃	4-CF ₃ Ph-	151 - 153
	760	$-CH_3$	4-ClPh-	143 – 144
15	761	$-CH_3$	3-ClPh-	136 – 138
	762	$-CH_3$	$3,4$ - Cl_2Ph -	142 - 143
	76 3	-CH ₃	4-CH₃OPh-	163 - 164
	764	-CH ₃	3-CF ₃ Ph-	105 - 107
	765	$-CH_3$	4-FPh-	139 – 140
	766	$-CH_3$	4-CF ₃ OPhCH ₂ OCO-	166 - 167
	767	$-CH_3$		186 – 188
	101		CF ₃ PhCH=CHCH ₂ OCO-	
	768		4-CF ₃ PhCH ₂ -	205 - 206
90	769	·CH ₃	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	133 - 134
20				

表31

-	実施例	R1	R2	mp(°C) or 1H NMR
5 -	770	-CH ₃	4-ClPh-	228.8 - 232.2
	771	_	4-CF ₃ OPh·	236.2 - 237.4
	772	-CH ₃	4-CF₃OPhCH₂-	CDCl ₃ ; 1.76(3H ,s), 3.03(4H, br), 3.62-3.67(4H, m), 4.01(1H, d, J=10.2Hz), 4.04(1H, d, J=10.2Hz), 4.18(1H, d, J=10.2Hz), 4.48(1H, d, J=10.2Hz), 5.15(2H, s), 6.76-6.80(2H, m), 6.85-6.89(2H, m), 7.19-7.23(2H, m), 7.38-7.42(2H, m), 7.54(1H, s)
	773	-CH ₃	4-ClPhCH ₂ -	174.2 - 175
	774	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCH ₂ OCO-	155.5 - 156.5
10	775	-СН ₃	4- CF ₃ PhCH=CHCH ₂ OCO-	155 – 159.8

15

 実施例
 R1
 R2
 R3
 R4
 R5
 R6
 mp(°C)

 776
 -CH₃ ·H ·H ·H ·H ·H ·H ·H 151 · 153.5

 777
 -CH₃ ·H ·H ·I ·I ·H ·H 220 · 221

 778
 -CH₃ ·H ·H ·Cl ·H ·H ·H 185 · 186.5

 779
 -CH₃ ·H ·H Morpholino ·H ·H 233 · 240 dec

 780
 -CH₃ ·H ·H Piperidino ·H ·H 217 · 218.5 dec

表33

5	実施例	R1	R2	R3	R4	mp(°C) or 1H NMR
_	781	-CH ₃	·H	·H	-CH ₃	230 - 231.5 dec
	782	-CH ₃	-H	-Cl	-CH ₃	201 - 204.5 dec
	783	-CH ₃	-H	-H	4·CF ₃ Ph-	258 - 259 dec
	784	$-CH_3$	-н	-H	4-ClPhCH ₂ -	207 - 208.4
	785				4-ClPh-	251 - 257 dec
	786	-CH ₃	-H	-H	CH ₃ CO-	206 - 207.5
	7 87	-CH ₃	-H	-Cl	C ₂ H ₅ OCO-	168.5 - 171
	788				t-BuOCO-	192 - 194.5
	789				C ₂ H ₅ OCO-	178.5 - 180.5
10	790	-CH ₃	-Cl	-Cl	t-BuOCO-	233 - 233.5 dec
	791	-CH ₃	-Cl	-Cl	C ₂ H ₅ OCO-	224.2 - 225.7
	792	-CH ₃	·H	-H	$-CO_2CH_2CF_3$	213 - 216
	793				$-CO_2C_4H_9$	197.5 - 199
	794				$-\mathrm{CO_2(CH_2)_7CH_3}$	198 - 201
	795 .	-CH ₃	·H	-H	$-\mathrm{CO_2(CH_2)_2OCH_3}$	176 · 179
	796	-CH ₃	·H	-Cl	4-CF ₃ OPhCH ₂ OCO-	153 - 155
	797				4-CF ₃ OPhCH ₂ OCO-	176 - 176.8
	798	-CH₃	·Cl	-Cl	4-CF ₃ OPhCH ₂ OCO-	196.5 - 197.5
	799	·CH ₃	·H	·H	4-CF ₃ OPhCH2OCO-	187 - 189
1 5	800	-CH ₃	·H	-H	4-CF ₃ PhCH ₂ OCO-	180.5 - 182.5
10	001	-CH ₃			4-	185 - 187
	801		·H	-H	CF ₃ PhCH=CHCH ₂ OCO-	
	802	-CH	-H	·H	3,4-Cl ₂ PhCH ₂ OCO-	171 - 171.5
	803	-CH	-H	·H	4-CF ₃ OPhNHCO-	228 – 232 dec
	804				$-\mathrm{CO_2(CH_2)_2N(CH_3)_2}$	CDCl ₃ : 1.76(3H ,s), 2.30(6H, s), 2.61(2H, t, J=5.8Hz), 2.99-3.04(4H, m), 3.60-3.64(4H, m), 4.03(1H, d, J=10.2Hz), 4.04(1H, d, J=10.1Hz), 4.18(1H, d, J=10.1Hz), 4.22(2H, t, J=5.8Hz), 4.49(1H, d, J=10.2Hz), 6.76-6.81(2H, m), 6.83-6.89(2H, m), 7.55(1H, s)
20						

表34

実施例	R1 R2	R3	mp(°C)
805	-CH ₃ -CH ₃	4-CF ₃ OPh-	127.2 - 129.7
806	-CH ₃ -CH ₃		131.5 - 133.6
807	-CH ₃ -CH ₈	4-NCPh-	149 - 152
808	-CH ₃ -CH ₃		84.2 - 86.8
809	$-CH_3$ $-CH_3$		116.2 - 116.6

表35

-	SD H= /D)	D1 D0	mp(°C) or 1H NMR						
-	実施例_	R1 R2	153.2 - 154.8						
_	810	-CH ₃ -OPh	CDCl ₃ ; 1.16-1.42(2H,m), 1.61(3H,s), 1.87-2.01(2H,m), 2.31-						
5									
		CTT + CTT 701 3.771	2.60(3H,m), 2.78-3.02(4H,m), 3.24-3.30(1H,m),						
	811	-CH ₃ 4-CF ₃ PhNH-	3.82(1H,d,J=8.1Hz), 3.91(1H,d,J=9.7Hz),						
			4.29(1H,d,J=9.7Hz), 6.54(2H,d,J=8.6Hz), 6.98-						
	0.4.0	GTT 4 GTD TO	7.36(2H,d,J=8.6Hz), 7.54(1H,s) 130 - 131.8						
	812	-CH ₃ 4-CF ₃ Ph-	117.5 - 118.5						
	813	-CH ₃ 4-CF ₃ PhCH ₂ -	146.5-147.5						
	814	-CH ₃ 4-ClPhCH ₂ -	177 - 179						
	815	-CH ₃ 4-ClPhCO-	98 - 100						
	816	-CH ₃ 4-CF ₃ PhCO-	119.4 - 120.7						
	817	-CH ₃ 4-CF ₃ OPhO-	141 - 144						
10	818	-CH ₃ 4-ClPhO-	89 - 91.7						
	819	-CH ₃ 3-CF ₃ PhO-	171 - 174.7						
	820	·CH ₃ 4·NCPhO·	124 - 128						
	821	-CH _s 4-FPhO-	113 - 115						
	822	-CH ₃ 4-CF ₃ OPhCH ₂ O-	138 - 140						
	823	-CH ₃ 4-ClPhCH ₂ O-	115 - 116.5						
	824	-CH ₃ 4-PhPhCH ₂ O-	79 - 81						
	825	-CH ₃ PhCH ₂ CH ₂ O-	80.8 - 83.9						
	826	-CH ₃ 4-PyridylCH ₂ O- -CH ₃ 3-PyridylCH ₂ O-	77 - 79						
	827 828	-CH ₃ 5-FyridyICH ₂ O -CH ₃ 4-CF ₃ OPhCH ₂ OCO							
	828 829	-CH ₃ 4-ClPhNHCO-	153 - 155						
15	830	-CH ₃ 4-CIPhCH ₂ NHCO-	161 - 164						
	831	-CH ₃ 4-ClPhNH-	159 - 161						
	832	·CH ₃ 4 ·NCPhNH·	148.5 - 150						
	833	-CH ₃ 4 NCI IIVII -CH ₃ 4-ClPhN(CH ₃)-	180.2 · 181.1 dec						
	834	-CH ₃ 4-NCPhN(CH ₃)-	188.5 - 191						
	835	-CH ₃ 4 ·CF3PhN(CH ₃)-	161 - 164						
	836	-CH ₃ (4-ClPh) ₂ N-	178.5 - 180						
	000	O113 (# O11 11/211							

表36

5	実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	mp(°C) or 1H NMR
U	837	$-CH_3$	-H	-H	$-CH(CH_8)_2$	-H	·H	158.5 - 160
	838	$-CH_3$	-H	-Cl	-Cl	·H	-H	115 - 117.9
	839	$-CH_3$	-H	-H	$-CF^3$	·H	-H	126 - 129.2
	840	$^{ ext{-}}\mathbf{H}$	-H	-H	$-CF_3$	-H	$\cdot \mathbf{H}$	164 - 166
	841	$-CH_3$	-H	-H	-OPh	-H	\mathbf{H}	157 - 158.2
	842	$-CH_3$	$-\mathbf{H}$	-OCH ₃	-OCH ₃	\cdot OCH ₃	-H	147 - 151.9
	843	-CH ₃	-H	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	-H	151 - 152.5
	844	$-CH_3$	- H	-H	-3-PYRIDYL	·H	$\cdot \mathbf{H}$	140 - 143.8
	845	-CH ₃	-H	-Ph	-H	-H	\mathbf{H}	94.6 - 96.5
	846	-CH ₃	-H	-H	cyclo-C ₆ H ₁₁	-H	\mathbf{H}	162 - 1 63.9
10	847	-CH ₃	-Ph	-H	-H	-H	-H	146.8 - 149
10	848	-CH ₃	-H	·H	-CH=CHPh	·H	\mathbf{H}	178.5 - 181.8
	849	-CH ₃	-H	·CF ₃	-H	$-\mathbf{CF_3}$	\mathbf{H}	154 - 156.2
15	850	-CH ₃	-Н	-Н	-н	-Н	-Н	CDCl ₃ , 1.59(3H, s), 2.34(4H, bs), 2.50-2.59(2H, m), 2.53(1H, d, J=14.8Hz), 2.67-2.76(2H, m), 2.85(1H, d, J=14.8Hz), 3.41(1H, d, J=12.9Hz), 3.47(1H, d, J=9.6Hz), 4.30(1H, d, J=9.6Hz), 7.23-7.33(5H, m), 7.53(1H, s) CDCl ₃ 1.58(3H, s), 2.30(4H, br), 2.49-2.57(2H, m), 2.52(1H, d,
10	851	-CH ₃	-H	-Н	-N(CH ₃) ₂	-н	-н	J=14.9Hz), 2.65·2.73(2H, m), 2.84(1H, d, J=14.9Hz), 2.93(6H, s), 3.34(2H, d, J=3.50Hz), 3.86(1H, d, J=9.6Hz), 4.30(1H, d, J=9.6Hz), 6.67(2H, d, J=8.7Hz), 7.11(2H, d, J=8.7Hz), 7.52(1H, s) CDCl ₈ , 1.59(3H, s), 2.31(4H, br), 2.50·2.58(2H, m), 2.53(1H, d,
20	852	-CH₃	-н	-Н	-OCH ₃	-Н	-H	J=13.0Hz), 3.79(3H, s), 3.88(1H, d, J=9.7Hz), 4.30(1H, d, J=9.7Hz), 6.83(2H, d, J=8.6Hz), 7.17(2H, d, J=8.6Hz), 7.52(1H, s)
25	853	$\cdot \mathrm{CH_3}$	-н	-н	-CH ₂ Ph	-H	-Н	CDCl ₃ 1.61(3H, s), 2.30-2.73(9H, m), 2.84(1H, d, J = 14.8Hz), 3.49(2H, s), 3.87(1H, d, J = 9.7Hz), 3.95(2H, s), 4.30(1H, d, J = 9.7Hz), 7.09-7.33(9H, m), 7.52(1H, s)

表37

	marker my	~~~						(A-1)
5	実施例	R1	<u> R2</u>	R3	R4	<u> K5</u>	R6	mp(°C) or 1H NMR
	854	$-CH_3$	-H	\cdot H	·Cl	·H	-H	176.8 - 181.3
	855	-CH ₃	$\cdot \mathbf{H}$	-H	-C1	-Cl	-H	111.8 - 114.8
	856	$-CH_3$	·H	\cdot H	-OCH ₃	-H	·H	183.3 - 186.6
	857	-CH ₃	-H	·H	-H	-H	-Cl	123.5 - 125.3
	858	-CH ₃	-Н	-Н	-н	·H	-н	CDCl ₃ ; 1.59(3H, s), 2.37(4H, bs), 2.51-2.61(2H, m), 2.54(1H, d, J=14.8Hz), 2.69-2.76(2H, m), 2.86(1H, d, J=14.8Hz), 3.44(1H, d, J=13.1Hz), 3.51(1H, d, J=13.1Hz), 3.88(1H, d, J=9.6Hz), 4.31(1H, d, J=9.6Hz), 7.29-7.36(3H, m) 7.39-7.47(2H, m), 7.51-7.60(4Hm), 7.53(1H, s)
10	859	-CH ₃	-H	-н	-CF ₃	-Н	·Н	CDCl ₃ ; 1.60(3H, s), 2.37-2.75(9H, m), 2.87(1H, d, J=14.9Hz), 3.49(2H, s), 3.88(1H, d, J=9.6Hz), 4.30(1H, d, J=9.6Hz), 7.37(1H, d, J=8.0Hz), 7.53(1H, s), 7.54(1H, d, J=8.0Hz), 7.68(4H, s)
	860	-CH ₃	-н	-H	·OCF ₃	-н	-Н	CDCl ₃ : 1.60(3H, s), 2.38(4H, br), 2.55(1H, d, J=14.9Hz), 2.60(2H, br), 2.71-2.76(2H, m), 2.87(1H, d, J=14.9Hz), 3.50(2H, s), 3.89(1H, d, J=9.7Hz), 4.30(1H, d, J=9.7Hz), 7.27(2H, d, J=6.6Hz), 7.36(2H, d, J=8.1), 7.47-7.52(2H, m), 7.53(1H, s), 7.55-7.61(2H, m)

表38

	実施例	R1	R2	mp(°C)
5	861	-СН3		134 - 138.8
	862	-CH ₃	$\overline{}$	188.6 - 190.7
10	863	-CH ₃		127 - 131.5
	864	-CH ₃	H	156 - 158.6
	865	-CH ₃	-NN	102.8-104.9
15	866	-CH ₃		1 29 - 133
	867	-CH ₃		164.0-168.5
	868	-CH ₃	-\s\	221.5 - 222.3
20	869	$-\mathrm{CH_3}$	H ₃ C O	158 - 159.4
	870	-CH ₃	CI	105 - 107
	871	-CH ₃		142 - 145.4
05				

表39

実施例 R1 R2 mp(°C) 5 872 -CH₃ 196 - 199.4 873 -CH₃ 102 – 104 -CH₃ 874 215.5 - 217 10 $\cdot \mathrm{CH_3}$ 875 195 - 197.8

表40

NO₂—R1
R2
R3
R6
R5

	実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	mp(°C) or 1H NMR
	876	-H	-H	·H	-CF ₃	-H	-H	175.8 - 176.6
	877	$\cdot CH_3$	-H	-H	·H	-H	-H	180.6 - 184.2
	878	$-CH_3$	-H	$^{ ext{-} ext{H}}$	- F	-H	-H	175 - 179.5
	879	$-CH_3$	$\cdot \mathbf{H}$	$\cdot \mathbf{H}$	-OCH ₃	-H	-H	172 - 172.5
	880	$-CH_3$	-H	$\cdot \mathbf{H}$	$-CO_2C_2H_5$	-H	-H	175 - 179.2
20	881	$-CH_3$	-H	-H	$-CH_3$	$-\mathbf{H}$	-H	185 - 185.5
	882	-CH ₃	·H	-H	-Cl	-Cl	-H	177 - 177.3
	883	$-CH_3$	$^{ ext{-} ext{H}}$	·H	-H	-CF ₃	-H	171.6 - 173.6
•	884	$-CH_3$	-H	-H	-H	-H	$-CF_3$	179.5 - 180.3
	885	$-CH_3$	$\cdot H$	$-\mathbf{H}$	-Cl	$-CF_3$	-H	170.5 - 171.2
	886	$-CH_3$	-H	-H	$-CO_2H$	-H	-H	248 - 252
	887	$-CH_3$	$\cdot \mathbf{H}$	-H	- H	-H	- F	191 - 192.2
	888	$-CH_3$	·H	\cdot H	$-N(CH_9)_2$	$\cdot \mathbf{H}$	\mathbf{H}	206 - 207
	889	·H	$\cdot \mathbf{H}$	-H	-F	·H	$\cdot \mathbf{H}$	178.5 - 179.5
	890	·H	-H	$\cdot \mathbf{H}$	-CN	·H	-H	211 · 211.5
	891	$\cdot \mathbf{H}$	·H	$\cdot H$	-Cl	-H	-H	183 - 183.5
25								CDCl ₃ ; 1.64(3H, s), 2.59-2.75(2H, m), 2.62(1H, d, J=15Hz), 2.80-2.95(2H, m), 2.93(1H, d,
	892	-CH ₃	·H	-H	$\cdot \mathrm{CF_3}$	-H	-H	J=15Hz), 3.00-3.25(4H, m), 3.94(1H, d, J=10Hz), 4.35(1H, d, J=10Hz), 6.86(2H, d,
								J=8Hz), 7.46(2H, d, J=8Hz), 7.53(1H, s)
	893	-CH ₃	·H	-H	CO ₂ C(CH ₃)	-H	-н	198.5 – 200.5

表41

$$NO_2 \longrightarrow NO_2 \longrightarrow$$

_								
5	実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	mp(°C)
	894	·CH ₃	·H	-H	-Cl	-H	-H	144.2 - 145.6
	895	$\cdot CH_3$	·H	-H	$-\mathbf{OCF_3}$	-H	-H	153 - 156.9
	896	$\cdot CH_3$	·H	·H	-Cl	-C1	-H	114.5 - 116.6
	8 97	$\cdot CH_3$	·H	-H	-H	-C1	-H	132.4 - 136.3
	898	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-Cl	143.5 - 145
	899	-CH ₃	-H	-H	$ ext{-}\mathbf{Br}$	-H	-H	151 - 152
	900	$-CH_3$	\mathbf{H}	-H	-Ph	-H	-H	134 - 135.2
	901	·CH ₃	-H	-H	$-CO_2CH_3$	-H	-H	127 - 130.5
	902	$\cdot CH_3$	-H	-H	$-OCH_3$	-H	-H	128 - 130
10	903	·CH ₃	$\cdot \mathbf{H}$	$-\mathbf{H}$	$-OCH_2Ph$	-H	-H	128 - 131
10	904	$-CH_3$	-Cl	·H	-H	·H	-Cl	142 - 145.5
	905	-CH ₈	-H	·Cl	-H	-Cl	-H	132 - 135.3
	906	-CH ₃	·H	$^{ ext{-}}\mathbf{H}$	-H	$-CF_3$	-H	117 - 118
	907	-CH ₃	- H	·H	$-CH_3$	-H	-H	117 - 118
	908	-CH ₃	$\cdot \mathbf{H}$	\mathbf{H}	-H	$-OCH_3$	-H	106 - 108
	909	$-CH_3$	-H	$\cdot \mathbf{H}$	-H	-H	$-CH_3$	143 - 145
	910	$-CH_3$	-H	-H	-H	·H	-OCH ₃	127 - 130
	911	$-CH_3$	\mathbf{H}	·H	-H	·H	$^{ ext{-}} ext{CF}_{ ext{s}}$	144 - 145
	912	$-CH_3$	-H	-H	$-OC_4H_9$	-H	-H	126 - 127
	913	$\cdot \mathrm{CH_3}$	-H	-H	$-NO_2$	-H	-H	156 - 158
	914	$-CH_3$	-H	$-CF_3$	-H	$-CF_3$	-H	159 - 160
15	915	$-CH^3$	-H	-H	-CN	·H	-H	125 - 129
	916	$-CH_3$	-H	-H	$-C(CH^3)^3$	-H	-H	147 - 149
	917	$-CH_3$	-H	-H	·H	$-CH_3$	-H	125 - 127
	918	$-CH_3$	-H	·H	$-CH_3$	$-CH_3$	-H	135 - 138
	919	$-CH_3$	-H	·H	$-OCH_3$	-OCH ₃	-H	149 - 151
	920	$-CH_3$	-H	$-\mathbf{H}$	-H	-H	-F	131 - 133
	921	$-CH_s$	-H	-H	$-C_2H_5$	-H	·H	144 • 146
	922	$-CH_3$	·H	-H	$-SO_2CH_3$	·H	-H	112 - 115
	923	$-CH_3$	-H	-H	$-CON(CH_3)_2$	-H	- H	108 - 111
	924	$-CH_3$	-H	-H	CONHC ₃ H ₇	-H	·H	124 - 126
	925	$-CH_3$	·H	-H	$-OCH(CH_3)_2$	-H	-H	122 - 123
20	926	$-CH_3$	·H	- H	$-OSO_2CH_3$	$\cdot \mathbf{H}$	·H	100 - 104
20	927	-CH ₃	-H	- H	-I	-H	-H	132 - 134
	928	-CH ₃	·H	$-\mathbf{H}$	-NHCOCH₃	-H	·H	105 - 109
	929	-CH ₃	-H	-H	$-CONH_2$	-H	-H	159 - 161
	930	$-CH_3$	·H	•H	-F	-Cl	-Н	148 - 149

表42

_	実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	mp(°C) or 1H NMR
5	931	-CH₃			-F	-Н	-н	CDCl ₃ 1.62(3H, s), 2.38-2.70(4H, bm), 2.56(1H, d, J=14.9Hz), 2.87(1H, d, J=14.9Hz), 3.41(4H, bs), 3.92(1H, d, J=9.7Hz), 4.28(1H, d, J=9.7Hz), 5.06(2H, s), 6.99-7.07(2H, m), 7.28-7.34(2H, m),
10	932	-CH ₃	-н	·н	$^{-}\mathbf{CF_{3}}$	-Н	-н	7.53(1H, s) CDCl ₃ 1.62(3H, s), 2.45-2.75(4H, bm), 2.58(1H, d, J=14.9Hz), 2.86(1H, d, J=14.9Hz), 3.20-3.60(4H, br), 3.94(1H, d, J=9.8Hz), 4.29(1H, d, J=9.8Hz), 5.15(2H, s), 7.44(1H, d, J=8.0Hz), 7.54(1H, s), 7.61(1H, d, J=8.0Hz)
	933	-CH ₃	-н	-Н	-ОН	-н	-н	CDCl ₃ 1.59(3H, s), 2.30-2.70(4H, m), 2.56(1H, d, J=15Hz), 2.86(1H, d, J=15Hz), 3.10-3.55(4H, m), 3.91(1H, d, J=10Hz), 4.28(1H, d, J=10Hz), 5.03(2H, s), 5.30(1H, brs), 6.84(2H, d, J=8Hz), 7.24(2H, d, J=8Hz), 7.53(1H, s) CDCl ₃ 1.61(3H, s), 2.35-2.70(4H, m),
15	934	•CH ₃	-Н	•н	$ m NH_2$	-H	·H	2.56(1H, d, J=15Hz), 2.85(1H, d, J=15Hz), 3.05-3.55(4H, m), 3.69(2H, brs), 3.91(1H, d, J=10Hz), 4.28(1H, d, J=10Hz), 4.98(2H, s), 6.55(2H, d, J=8Hz), 7.14(2H, d, J=8Hz), 7.53(1H, s)
	935	-CH ₃			(CH ₃) ₃ C(CH ₃) ₂ Si-		·H	114 - 115
	936	-CH ₃	-H	•H	(CH ₃) ₃ COCONH-	<u>-H</u>	·H	124 - 127

表43

実施例	R1	R2	mp(°C)
937	·CH ₃	-(CH ₂) ₂ Ph	143.5 · 144.6
938	·CH ₃	$4 \cdot \text{ClPh}(\text{CH}_2)_2$	118 - 119
939	-CH ₃	4-ClPhCH=CHCH2-	121 - 123.3
940	$-CH_3$	4-CF ₈ PhCH=CHCH ₂ -	121 - 122
941	-CH ₃	4- CF ₃ OPhCH=CHCH ₂ -	127 – 128

914

表44

	実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	mp(°C) or 1H NMR
5	942	·CH ₃	-H	·H	·H	-Cl	-H	83 - 85
	943	$-CH_3$	-H	·H	- F	·H	·H	174 - 175
	944	$-CH_3$	-H	·H	-H	-H	$\cdot CH_3$	187 - 188.5
	945	$-CH_3$	-H	-H	-H	-H	-H	163.5 - 165.5
	946	-CH ₃	-H	-H	-Cl	-H	-H	172.5 - 174
	947	·H	$\cdot \mathbf{H}$	-H	-OCF ₃	° -Н	$-\mathbf{H}$	128 - 129
	948	$-CH_3$	-H	-H	-Cl	-Cl	-H	97 - 98
	949	-CH ₃	$-\mathbf{H}$	-H	- F	- F	-H	115 - 116
	950	$-CH_3$	-H	-H	·H	-F	-F	101 - 103
	951	$-CH_3$	\mathbf{H}	-F	·H	- F	-H	85 - 87
	952	$-CH_3$	-F	$\cdot \mathbf{F}$	- F	- F	- F	143 - 144
10	953	-CH ₃	-F	·H	- F	-H	-F	92 - 95
20	954	-CH ₃	-H	·F	-H	·H	-F	144 · 146
	955	-CH ₃	-F	-H	·H	-H	-F	169 - 170
	956	-CH ₃	-H	-H	-F	-H	-F	178 - 182
	957	-CH ₃	$\cdot \mathbf{H}$	·H	-H	- F	-H	112 - 115
	958	$-CH_3$	-H	-H	- H	$-\mathbf{CF_3}$	-H	78 - 80
	959	$\cdot CH_3$	-H	-H	·H	-H	-F	175 - 176
	960	$-CH_3$	-H	-H	$\cdot \mathbf{Br}$	-H	-H	166 - 167
	961	-H	-H	-H	${}^-\mathbf{F}$	-H	-H	121.5 - 122
	962	$^{ ext{-}}\mathbf{H}$	-H	-H	-C1	- H	-H	112.9 - 116.7
	963	$\cdot \mathbf{H}$	-H	-H	-C1	·Cl	-H	105.5 - 106
15	964	·H	-H	-H	-H	-C1	-H	97.5 - 98
19	965	-H	-H	$^{ ext{-}}\mathbf{H}$	-H	-F	-H	93 - 94
	966	$-CH_3$	-H	-H	-OCHF ₂	-H	- H	134 - 135
	967	$-CH_3$	-H	·H	- F	$-OCH_3$	- F	71 - 74
	968	$-CH_3$	-H	·H	- F	$-OCHF_2$	-F	84 - 86
	969	$-CH_3$	\cdot H	·H	-Cl	\cdot OCHF ₂	-H	85 - 87
	970	$-CH_3$	-H	-H	-C1	·H	-H	180 - 181
	971	-CH ₃	-H	-H	${}^{\text{-}}\mathbf{CF_{s}}$	- H	-H	185 - 187
	972	$-CH_3$	·H	-H	$-OCF_3$	-H	$-\mathbf{H}$	172 - 173
	973	$-CH_3$	·H	-H	-OCH ₂ CF ₃	-Ħ	·H	76 - 80
	974	-CH ₃	-H	-H	-Cl	-OCH ₂ CF ₃	-H	139 - 140

表45

	実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	mp(°C) or 1H NMR
5	975	-CH ₃	-Н	٠Н	-OCH ₂ CF ₃	-Cl	-н	CDCl ₃ 1.62(3H, s), 2.40-2.75(4H, m), 2.57(1H, d, J=15Hz), 2.87(1H, d, J=15Hz), 3.05-3.50(4H, m), 3.92(1H, d, J=10Hz), 4.28(1H, d, J=10Hz), 4.40(2H, q, J=8Hz), 5.02(2H, s), 6.40(2H, d, J=8Hz), 7.21(2H, dd, J=8,2Hz), 7.39(1H, d, J=2Hz), 7.53(1H, s)
	976	-CH ₃	-Н	-н	-OCHF ₂	-Cl	·н	CDCl ₃ 1.62(3H, s), 2.40-2.70(4H, m), 2.59(1H, d, J=15Hz), 2.87(1H, d, J=15Hz), 3.10-3.55(4H, m), 3.96(1H, d, J=10Hz), 4.30(1H, d, J=10Hz), 5.13(2H, s), 6.53(1H, t, J=73Hz), 7.10-7.30(2H, m), 7.42(1H, s), 7.55(1H, s)
10	977	-CH₃	-Н	-н	-Br	-OCHF ₂	-F	CDCl ₃ 1.62(3H, s), 2.40-2.65(4H, m), 2.59(1H, d, J=15Hz), 2.86(1H, d, J=15Hz), 3.00-3.50(4H, m), 3.96(1H, d, J=10Hz), 4.29(1H, d, J=10Hz), 5.14(2H, s), 6.59(1H, t, J=73Hz), 7.17(1H, m), 7.39(1H, m), 7.55(1H, s)

•	実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	mp(°C)
	050	·CH ₃	-H	-H	-CF ₃	•H	·H	139.8 -
20	978	_						141.7
20	979	$-CH_3$	-H	-H	·H	-Cl	$^{ ext{-} ext{H}}$	108 - 111
	980	$-CH_3$	\cdot H	-H	\mathbf{H}	$-\mathbf{H}$	$-CH_3$	185 - 186
	981	$-CH_3$	-H	$-\mathbf{H}$	-Cl	$-\mathrm{CF_3}$	-H	115 - 115.5
	982	$-CH_3$	-H	-H	$^{-}\mathrm{CF_{3}}$	$-\mathrm{CH_3}$	$-\mathbf{H}$	91 - 91.5
	983	$-\mathrm{CH_3}$	\mathbf{H}	$\cdot \mathbf{H}$	$-SCF_3$	-H	-H	136.5 - 137
	984	$-CH_3$	$\cdot H$	-H	${}^{ ext{-}}\mathbf{F}$	-C1	-H	72.5 - 73
	985	$-CH_3$	-H	-H	-Cl	<u>-H</u>	$-CH_3$	178.5 - 179

表47

	実施例	R1	R2	mp(°C)
	986	·CH ₃	-CH ₂ -cyclo-C ₆ H ₁₁	101 · 103
5	987	$\cdot CH_3$	-cyclo-C ₆ H ₁ ,	189.6 - 191.6
_	988	-CH ₃	·CH ₂ CF ₃	123.5 - 124
	989	-CH ₃	-CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	138 · 138.5
	990	$-CH_3$	(E)-3,4-Cl ₂ PhCH=CHCH ₂ -	145 - 148
	991	-CH ₃	(E)-4-ClPhCH=CHCH ₂ -	124 · 125
	992	-CH ₃	(E)-4-CF ₃ OPhCH=CHCH ₂ -	60 - 61
	993	-H	(E)-4-ClPhCH=CHCH ₂ -	113 - 114
	994	-H	(E)-4-ClPhC(CH ₃)=CHCH ₂ -	109 - 110
	995	-H	(Z)-4-ClPhC(CH ₃)=CHCH ₂ -	95 - 96
	996	$-CH_3$	(E)-4-CF ₃ PhCH=CHCH ₂ -	132 - 133
	997	$-CH_3$	(Z)-4-CF ₃ PhCH=CHCH ₂ -	138 - 140
10	998	-CH ₃	(E)-3-CF ₃ -4-ClPhCH=CHCH ₂ -	147 - 149
10	999	$\cdot \mathrm{CH_s}$	(E)-4-FPhCH=CHCH ₂ -	155 - 156
	1000	$-CH_3$	(E)-4-CF ₃ PhCH=C(CH ₃)CH ₂ -	122 - 123
	1001	-CH₃	(4-CF ₃ Ph) ₂ C=CHCH ₂ -	145 - 146
	1002	-CH ₃	4-ClPh(CH ₂) ₂ -	150 - 151
	1003	$-CH_3$	4-ClPh(CH ₂) ₃ -	96 - 97
	1004	$-CH_3$	4-ClPh(CH ₂) ₄ -	78 - 82
	1005	$-CH_3$	4-ClPhO(CH ₂) ₂ -	138 - 139
	1006	$-CH_3$	4-CF ₃ OPh(CH ₂) ₃ -	46 - 48
	1007	-CH ₃	4-CF ₃ Ph(CH ₂) ₈ -	118 - 120
	1008	·CH ₃	4-CF ₃ PhO(CH ₂) ₂ -	104 - 108
	1009	$-CH_3$	4-CF ₃ OPhN(CH ₃)(CH ₂) ₂ -	102 - 104
15				CDCl ₃ 1.62(3H, s), 2.02-2.10(3H, m),
				2.57(1H, d, J=14.9Hz), 2.40-2.73(4H, m),
	1010	$\cdot CH_s$	(E)-4-ClPhC(CH ₃)=CHCH2-	2.87(1H, d, J=14.9Hz), 3.06-3.62(4H, m),
		•		3.93(1H, d, J=9.7Hz), 4.29(1H, d, J=9.7Hz),
				4.76(2H, m), 5.87(1H, dt, J=1.3Hz, 6.7Hz),
				7.23-7.37(4H, m), 7.54(1H, s)
				CDCl _s 1.62(3H, s), 2.02-2.10(3H, m), 2.58(1H, d, J=14.9Hz), 2.35-2.72(4H, m),
				2.86(1H, d, J=14.9Hz), 3.04-3.56(4H, m),
	1011	-CH ₃	(Z)-4-ClPhC(CH ₃)=CHCH2-	2.50(11), d, J=14.5112), 5.04 5.50(41), m/, 3.94(1H, d, J=9.8Hz), 4.30(1H, d, J=9.8Hz),
	1011	Oilg	(2) 4 OH HO(OH3)—CHOH2	4.46(2H, m), 5.66(1H, dt, J=1.4Hz, 7.0Hz),
				7.04-7.12(2H, m), 7.23-7.35(2H, m),
20				7.53(1H, s)

表48

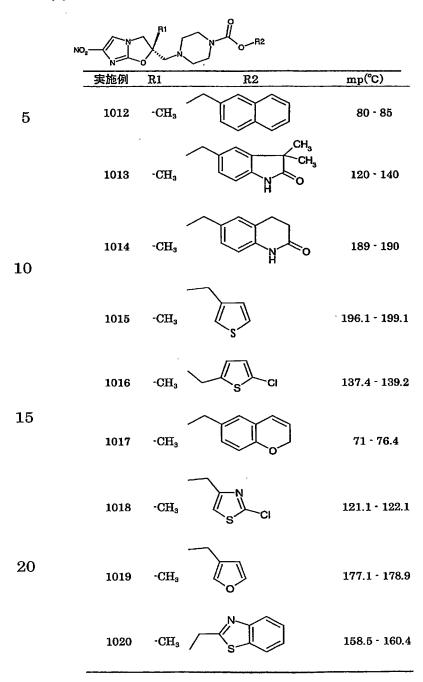
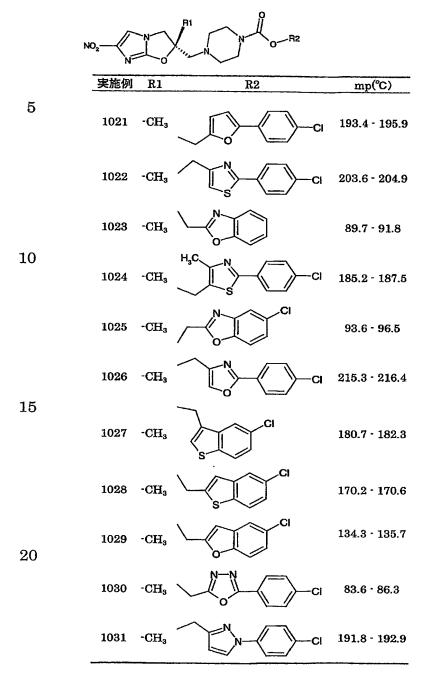


表49



	実施例	R1	R2	mp(°C) or 1H NMR
5	1032	-CH ₃	CH ₃	174.3 - 179.2
	1033		N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	108.9 - 113.1
10	1034		N=N-CI	193.5 - 194.7
	1035	·H	N S	152 - 153.5
15	1036	-H	S C	190.3 - 191.2
15	1037	-H	S	177.5 - 180.9
	1038	-CH ₃	N N N CI	127.5 - 128.1
20	1039	-CH ₃	O CF	140 - 141.5
	1040	-CH ₃		114 - 117
_	1041	-CH ₃		CDCl ₃ 1.40-1.62(5H, m), 1.80-1.93(2H, br), 2.46-2.64(13H, m), 2.87(1H, d, J=14.9Hz), 3.37(4H, br), 3.92(1H, d, J=9.7Hz), 4.20(2H, t, J=6.1), 7.53(1H, s)

表51

実施例	R1	R2	mp(°C)
1042		4-CF ₃ OPh-	160.5 - 161.4
1043	-CH ₃	4-CF ₃ Ph-	158.6 - 160.6
1044	-CH ₃	4-CH₃OPh-	138.5 - 139.5
1045	-CH ₃	Ph-	163 - 163.5
1046	$-CH_3$	4-FPh-	159 - 160
1047	$-CH_3$	PhCH ₂ -	141.5 - 142
1048	$-CH_3$	4-ClPh-	177 - 178
1049		4-NCPh-	158 - 159
1050	$-CH_3$	4-ClPhCH ₂ -	144 - 145
1051		4-CF ₃ PhCH ₂ ·	95.5 - 97
1052	$-CH_3$	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	143 - 143.5
1053	-CH ₃	4-CF ₃ PhCO-	160.5 - 162.4
1054		4-ClPhCO-	218 - 220.3
1055	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCO-	169.8 - 172.7

表52

15

10

20

天他例	<u>H1</u>	H2	нз	R4	R5	R6	Mp(°C)
1056	-H	-H	-H	-CF ₃	·H	-H	215.3 - 217.8
1057	-H	-H	-H	-Br	-H	-H	219.2 - 221.3
1058	-H	-F	-H	-Br	-H	-H	198.8 - 200.5
1059	-H	-H	-F	-CI	-H	-H	199 - 199.5
1060	-H	-H	-H	-CN	-H	-H	180.2 - 184.1
1061	-H	-F	-F	-F	-H	-H	188.5 - 189.2
1062	-H	-H	-F	-F	-F	-H	191.7 - 192.6
1063	-H	-F	-H	-CI	-H	-H	202.8 - 203.3

5

実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	mp(°C)
1064	-H	-H	-H	-CI	-H	-H	214.2 - 214.8
1065	-H	-H	-CI	-CI	-H	-H	204.1 - 205.7
1066	-H	-H	-CF ₃	-H	-H	-H	127.8 - 131.8
1067	-H	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	204.2 - 205.3
1068	-H	-H	-H	-F	-H	-H	199.2 - 200.2

10 表54

実施例	R1	R2	R3	R4	R5	mp(°C)
1069	-H	-H	-CI	-H	-H	164.6 - 165.9
1070	-H	-H	-CF₃	-H	-H	194.9 - 196
1071	-H	-H	-OCF₃	-H	-H	211.7 - 212.1
1072	-H	-H	-H	-CF ₃	-H	182.9 - 1 85.9

表55

	実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	mp(°C)
	1073	-H	-H	-H	-F	-H	-H	202.5 - 203.1
	1074	-H	-H	-H	-OCH₃	-H	-H	205.4 - 206.4
	1075	-H	-H	-H	-CI	-H	-CI	162.7 - 164
	1076	-H	-H	-H	-Cl	-H	-H	233.7 - 236.2
	1077	-H	-H	-H-	-1-PYRRYL	-H	-H	249.1 - 249.7
	1078	-H	-H	-H	-Ph	-H	-H	211.6 - 212
10	1079	-H	-H	-H	-OCH₂Ph	-H	-H	202.2 - 203.9
10	1080	-H	-H	-H	-Br	-H	-H	224.4 - 226.2
	1081	-H	-H	-H	-OC ₈ H ₁₇	-H	-H	156.8 - 158.3
	1082	-H	-H	-H	-CN	-H	-H	197.8 - 198.7
	1083	-H	-H	-H	-OPh	-H	-H	198.1 - 200.1
	1084	-H	-H	-F	-F	-F	-H	193.8 - 196
	1085	-H	-CH₃	-H	-CH₃	-H	-CH₃	177.9 - 178.3
	1086	-H	-CH₃	-H	-H	-H	-CH₃	175.7 - 178.2
	1087	-H	-H	-CF₃	-H	-CF ₃	-H	200.2 - 202.3
	1088	-H	-H	-H	-CI	-F	-H	197.2 - 199.2
	1089	-H	-H	-H	-Br	-H	-F	206.1 - 207.4
15	1090	-H	-H	-H	· -F	-F	-F	174 - 174.7
	1091	-H	-H	-H	-Cl	-H	-F	202.8 - 203.7
	1092	-H	-H	-H	-C₄H ₉	-H	-H	162.2 - 165.1
	1093	-H	-H	-H	-N(Ph) ₂	-H	-H	182.6 - 186.4
	1094	-H	-H	-H	-H	-Cl	-CI	223.5 - 224.5
	1095	-H	-H	-H	-1	-H	-H	217 - 221.1
	1096	-H	-H	-H	- 1-(1,2,4-triazolyl)	-H	-H	200.6 - 202.3

表 5 6

	実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	MS
5	1097	-H	-H	-H	-H	-Н	-H	370
	1098	-H	-CI	-H	-H	-H	-H	404
	1099	-H	-H	-CI	-H	-H	-H	404
	1100	-H	-F	-H	-H	-H	-H	388
	1101	-H	-H	-H	-CH(CH ₃) ₂	-H	-H	412
	1102	-H	-H	-H	-NO ₂	-H	-H	415
	1103	-H	-CF₃	-H	-H	-H	-H	438
	1104	-H	-H	-CF ₃	-H	-H	-H	438
	1105	-H	-H	-H	-C(CH ₃) ₃	-H	-H	426
10	1106	-H	-H	-H	-OC₂H₅	-H	-H	414
	1107	-H	-CI	-Cl	-H	-CI	-H	472
	1108	-H	-CI	-CI	-H	-H	-CI	472
	1109	-H	-H	-H	-H	-OPh	-H	462
	1110	-H	-H	-F	-H	-H	-F	406
	1111	-H	-F	-H	-F	-H	-H	406
	1112	-H	-H	-H	-F	-F	-H	406
	1113	-H	-H	-F	-H	-F	-H	406
	1114	-H	-H	-H	- F	- F	-F	424
15	1115	-H	-H	-F	-H	-F	-F -	424
19	1116	-H	-F	-H	- <u>н</u>	-F	-F	424
	1117	-H	-H	-F	-F -	-H	-F	424
	1118	-H	-F	-H	-F	-H	-F	424
	1119	-H	-OCF ₃	-H	-H	-H	-H	454
	1120	-H	-H	-H	-C₂H₅	-H	-H	398
	1121	-H	-H	-H	-H	-Br	-H	448
	1122	-H	-Br	-H	-H -H	-H -F	-H -F	448
	1123	-H -H	-H -Cl	-H -H	-п -Н	-r -H	-F -Cl	406
00	1124	-H	-OC ₂ H ₅	-n -H	-n -H	-п -Н	-U	438 414
20	1125	-H	-00 ₂ /1 ₅ -H	-/ 1 -H	-OC₄H ₉	-n -H	-11 -H	442
	1126 1127	-H	-H	-H	-004119 -H	-H	-OCH₂Ph	476
	1127	-H	-H	-H	-H	-NO ₂	-00H2H	415
	1129	-H	-H	-H	-H	-OCF ₃	-H	454
	1130	-H	-H	-H	-CI	-CI	-H	438
	1131	-H	-Cl	-H	-H	-CI	-H	438
	1132	-H	-H	-H	-H	-OCOCH₃	-H	428
	1133	H	-NO₂	-H	-H	-H	-H	415
	1134	-H	-H	-H	-H	-F	-H	388
25	1135	-H	-H	-CI	-H	-CI	-H	438
	1136	-H	-H	-H	-H	-CN	-H	395
	1137	-H	-H	-OCH₃	-H	-H	-H	400
	1138	-H	-OCH₃	-OCH₃	-H	-H	-H	430
	1139	-H	-OCH ₃	-H	-OCH ₃	-H	-H	430
	1140	-H	-OCH ₃	-H	-н "	-OCH₃	-H	430

表57

	実施例	R1	R2	R3			· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·	
~	1141	-H	-H		R4	R5	R6	MS
5		-H		-H	-OCH₃	-OCH₃	-H	430
	1142		-H	-H	-OCH ₃	-OCH₃	-OCH₃	460
	1143	-H	-H	-CI	-H	-Н	-NO ₂	449
	1144	-H	-H	-H	-OCH₃	-H	-NO ₂	445
	1145	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	-NO₂	445
	1146	-H	-H	-H	-H	-Ph	-H	446
	1147	-H	-NHSO₂CH₃	-H	-H	-H	-H	463
	1148	-H	-H	-H	-CH₃	-H	-H	384
	1149	-H	-H	-H	-CH₃	-CH₃	-H	398
	1150	-H	-CH₃	-H	-CH₃	-H	-H	398
10	1151	-H	-H	-H	-H	-CH₃	-H	384
	1152	-H	-H	-CH₃	-H	-H	-CH₃	398
	1153	-H	-H	-H	-H	-H	-CH₃	384
	1154	-H	-H	-H	-H	-CH₃	-CH ₃	398
	1155	-H	_. -H	-H	-OCOCH3	-H	-H	428
	1156	-H	-н	-H	-OC₃H ₇	-H	-H	428
	1157	-H	- I-f	-H	-NHCOCH₃	-H	-H	427
	1158	-H	-H	-CH₃	-H	-CH₃	-H	398
	1159	-H	-H	-CH₃	-CH₃	-H	-CH₃	412
	1160	-H	-H	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	-H	428
15	1161	-H	-H	-H	-CH=CHPh(trans)	-H	-H	472
	1162	-H	-H	-H	-N(CH ₃) ₂	-H	-H	413
	116 3	-H	-H	-Br	-H	-H	-OCH₃	478
	1164	-H	-H	-H	-F	-H	-CI	422
	1165	-H	-H	-Br	-H	-H	-F	466
	1166	-H	-H	-OCH₃	-H	-H	-F	418
	1167	-H	-H	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-H	426
	1168	-H	-Br	-H	-OCH ₃	-OCH₃	-H	508
	1169	-H	-F	-F	-F	-F	-F	460
	1170	-H	-H	-H	-N(CH ₃) ₂	-H	-OCH₃	443
20	1171	-H	-H	-OCH₂Ph	-H	-OCH₂Ph	-H	582
	1172	-H	-H	-H	-OCH₂Ph	-OCH₂Ph	-H	582
	1173	-H	-H	-H	-H	-OC₂H₅	-H	414
	1174	-H	-H	-H	-H	-OCH₂Ph	-H	476
	1175	-H	-H	-H	-OCH₂Ph	-OCH₃	-H	506
	1176	-H	-H	-H	-SC ₂ H ₅	-H	-H	430
	1177	-H	-H	-H	-OCHF ₂	-H .	-H	436
	1178	-H	-H	-H	-OCH(CH ₃) ₂	-H	-H	428
	1179	-H	-H	-H	-OCH₃	-Br	-H	478
	1180	-H	-H	-H	$-N(C_2H_5)_2$	-H	-H	441
25	1181	-H	-H	-H	-OCH₃	-F	-H	418
40	1182	-H	-H	-H	-OCH₃	-CH₃	-H	414
	1183	-H	-OCH₃	-H	-H	-F	-H	418
	1184	-H	-CI	-H	-H	-NO ₂	-H	449
								

表58

•	chith mi		HI					
-	実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	MS
5	1185	-H	-н	-Н	-OC ₂ H ₅	-OC ₂ H ₅	-Н	458
	1186	-H	-н	-Н	-OCO CH ₃	-OCH ₃	-H	458
	1187	-H	-NO₂	-H	-OCH₃	-OCH₃	-H	475
	1188	-H	-H	H	-SCH ₃	-н ँ	-H	416
	1189	-H	-H	-H	-CI	-NO ₂	-H	449
	1190	-H	-H	-H	-SO₂CH₃	-H	-H	448
	1191	-H	-H	-H	-OCH₃	-OCH,Ph	-H	506
	1192	-H	-H	-H	-CI	-CF₃	-H	472
	1193	-H	-1	-H	-H	-H	-H	496
	1194	-H	-H	-H	-H	-SCF ₃	-H	470
	1195	-H	-OCH₃	-H	-OCH₃	-OCH _a	-H	460
10	1196	-H	-H	-OCH₃	-н ँ	-OCH₃	-H	430
	1197	-H	-CO₂CH₃	-H	-H	-H	-H	428
	1198	-H	-OCH₃	-H	-H	-H	-OCH ₃	430
	1199	-H	-OCH ₃	-H	-OCH₃	-Н	-OCH _a	460
	1200	-H	-OCHF2	-H	-H [°]	-H	-H	436
	1201	-H	-H	-Br	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	508
	1202	-H	-H	-CH₃	-OCH₃̈́	-H	-CH _a	428
	1203	-H	-H	-H	-OH	-Н	-H	386
	1204	-H	-H	-OCH ₉	-OH	-OCH ₃	-H	446
	1205	-H	-H	-H	-OH	-H	-ОН	402
	1206	-H	-H	-H	-H	-Н	-OCH ₃	400
15	1207	-H	-F	-H	-H	-H	-F	406
	1208	-H	-H	-H	-3-PYRIDYL	-H	-H	447
	1209	-H	-H	-H	-OCH₂Ph	-Ci	-H	510
	1210	-H	-H	-H	-2-THIENYL	-H	-H	452
	1211	-H	-H	-OCH₃	-OCH ₃	-OCH₃	.: -Н	460
	1212	-H	-H	-H	-cyclo-C ₆ H ₁₁	-H	.н -н	452
	1213	-H	-H	-H	CH ₂ =CHCH ₂ O-	-H	-H	426
	1214	-H	-H	· -H	Pyrrolidinyl-	-H	-H	439
	1215	-H	EtOCOCH ₂ O-	-H	H	-H	.: -Н	472
	1216	-H	-H	-H	-OCH₃	cyclo-C ₅ H ₉ O-	-H	484
	1217	-H	-H	CF ₃ CF ₂ O-	-н ҇	-H	-H	504
20	1218	-H	-H	-н [*]	lmidazolyl-	-H	-H	436
	1219	-H	-H	-H	Piperidino-	-H	-H	453
	1220	-H	-H	-H	4-CF ₃ Ph-	-H	-H	514
	1221	-H	-H	-H	4-CH₃OPh-	-H	-H	476
	1222	-H	-H	-H	(CH ₃) ₂ N(CH ₂) ₃ O-	-H	-H	471
	1223	-H	-H	-H	Morpholino-	-NO ₂	-H	500
	1224	-H	-H	-H	Piperidino-	-NO ₂	-H	498
	1225	-H	-H	-H	4-FPh-	-H	-H	4 9 6
	1226	-H	-H	-H	4-CH ₃ (CH ₂) ₈ Ph-	-H	-H	572
	1227	-H	-H	-H	3,4-F ₂ Ph-	-H	-H	482
	1228	-H	-H	-H	4-CH ₃ (CH ₂) ₃ Ph-	.н -н	-H	402 502
25	1229	· -H	-H	-H	3-Cl-4-FPh-	-H	-H	498
						· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·	-11	430

表59

	実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	MS
-	1230	-H	-H	-Н	4-CF ₃ OPh-	-H	-H	530
5	1231	-H	-H	-H	4-CH ₃ Ph-	-H	-H	460
	1232	-H	-H	-H	4-NCPh-	-H	-H	471
	1233	-H	-H	-H	3,4-(CH ₃ O) ₂ Ph-	-H	-H	506
	1234	-H		-OCH₂O-	-H	-H	-H	414
	1235	-H	-H	-OCH ₂ O		-H	-CI	448
	1236	-H	-H	-OCH ₂ O		-H	-H	414
	1237	-H	-H	-OCH ₂ O		-OCH₃	-H	444
	1238	-H	-NO₂	-H	-OCH₂O-	00.13	-H	459
		•••	1102	••	-001/20-		••	409
10	1239	-H	-H	-Н	—N—CH ₃	-F	-H	486
	1240	-H	-н	N CH ₃	-Н	-H	-NO2	617
	1241	-H	-Н		-н	-Н	-NO2	589
15	1242	-н	-н	O CH ₃ CH ₃	-н	-Н	-ОСНЗ	587
	1243	-н	-Н	-Н	-N	-H	-Н	437
20	1244	-н	-Н	-н		-H	-H	626
	1245	-н	-Н	-Н		-H	-Н	513
25	1246	-Н	-H	-H		-н	-н	486

表60

表61

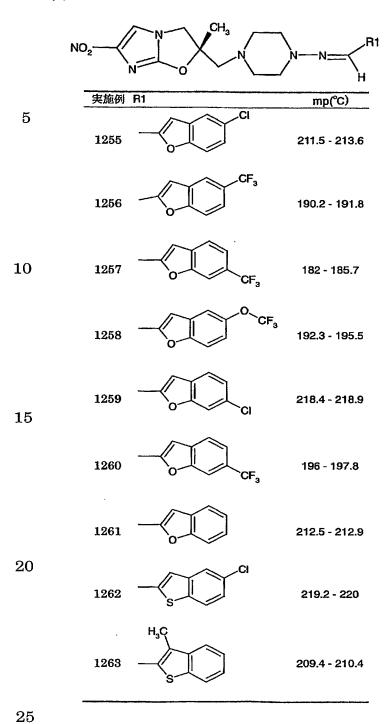


表62

5	実施例 F	R1	mp(℃) or MS
	1264	Br	205.4 - 206.6
	1265	OMe	214.7 - 215.2
10	1266		420
	1267	Br	498
15	1268		420
	1269	CH3	463
20	1270	MeO	450

表63

	NO ₂ CH ₃	N-N-R1
	実施例 R1	mp(℃) or MS
5	1271	227.6 - 228.3
	1272	428
10	1273	494
	1274	376
	1275	374

表64

	NO ₂ CH ₃	N-N-R1
	実施例 R1	mp(℃) or MS
5	1276	360
	1277 CH ₃	374
10	1278 CH ₃	388
10	1279 OBr	230.6 - 232.6
	1280 CI	470
15	1281 NO	₂ 481
	1282 CI	470
	1283 OF ₃	504
20	1284 O CI	538
•	1285 O ₂ N	481

表 6 5

表66

表 6 7

表68

表70

$$\mathsf{NO_2} \overset{\mathsf{CH_3}}{\longleftarrow} \mathsf{N} \overset{\mathsf{CH_3}}{\longleftarrow} \mathsf{N} \overset{\mathsf{R1}}{\longleftarrow} \mathsf{N} \overset{\mathsf{N}}{\longleftarrow} \mathsf{N} \overset{\mathsf{N}}{\overset{\mathsf{N}} \overset{\mathsf{N}}{\longleftarrow} \mathsf{N} \overset{\mathsf{N}}{\longleftarrow} \mathsf{N} \overset{\mathsf{N}}{\longleftarrow} \mathsf{N} \overset{\mathsf{N}}{\overset{\mathsf{N}} \overset{\mathsf{N}}{\longleftarrow}$$

	実施例	R1	mp(℃) or MS
5	1325	OMe OMe	507
	1326	-CI	481
10	1327	-CI	499
	1328		453
	1329		437
15	1330	S	377
	1331		189.4 - 190.6
20	1332	NO ₂	498
	1333	T _s	453
	1334	OMe	483
25	1335	S	487
	1336	CI	201.2 - 203.5

表71

表73

表7.4

実施例 R1 R2 R3 R4 R5 mp(°C) 1362 -H -H -F -H -H 187 - 188 1363 -H -H -CI -H -H 183 - 184 -H 1364 -OCH₃ -OCH₃ -OCH_a -H 169 - 170 1365 -H -CI -CI -H -H 174 - 175 -CI 1366 -H -H -H -CI 208 - 209 10 1367 -F -F -H -H -H 184 - 185 1368 -H -F -F -H -H 185 - 186 1369 -H -H -CO₂CH₃ -H -H 183 - 184.5 -CO₂C₂H₅ 1370 -H -H -CO₂C₂H₅ -H 181 - 182 1371 -H -H -OCH₃ -H -H 175 - 176 1372 -CI -H -H -H -H 173 - 174.5 1373 -H -CI -H -H -H 173 - 174 -CF₃ 1374 -H -H -H -H 184 - 186 -CF₃ 1375 -H -H -H -H 188 - 190 1376 -H -H -Ph -H -H 187 - 188 **1**5 1377 -H -CF₃ -H -CF₃ -H 183 - 184 1378 -F -F -F -F -F 235 - 237 -H 1379 -H -SCH₃ -H -H 177 - 179 -H 1380 -H -C(CH₃)₃ -H -H 201 - 202 -CH₃ 1381 -H -H -H -H 183 - 185 -OCF₃ -H 1382 -H -H -H 190 - 191 1383 -OCF₃ -H -H -H 188 - 189

表 7 5

5	実施例	R1	mp(°C)
	1384	(CH ₃)₂CH-	251-253
	1385	(CH ₃) ₂ CHCH ₂ -	233-235
	1386	C _a H ₁₂ -	219-220
	1387	Ph(CH ₂) ₂ -	198-200
	1388	PhCH=CHCH ₂ -	180-181
	1389	Ph(CH ₂) ₃ -	186-187.5
	1390	(Ph)₂CH-	202-204
	1391	Ph-	242-244
	1392	2-NaphthylCH₂-	173.5-174.5
	1393	4-PyridylCH ₂ -	163-164
10	1394	4-CIPh(CH ₂) ₂ -	198-200
	1395	(4-CIPh)₂CH-	238-240
	1396	4-CH ₃ Ph-	230-231
	1397	4-CH ₃ OPh-	248-250
	1398	2-BocNHPhCH ₂ -	144-145
	1399	CH ₃ OCH ₂ CH ₂ -	1.80-2.00 (m, 2H), 2.15-2.25 (m, 2H), 3.30-3.40 (m, 5H), 3.68 (t, 2H, J = 4.5Hz), 3.95-4.20 (m, 4H), 4.27 (t, 2H, J = 4.5Hz), 7.54 (s, 1H)
15	1400	N CH3	1.46 (s, 9H), 1.80-1.95 (m, 2H), 2.05-2.15 (m, 2H), 2.40-2.50 (m, 4H), 2.66 (t, 2H, J = 5Hz), 3.25-3.45 (m, 6H), 3.90-4.10(m, 4H), 4.24 (t, 2H, J = 5Hz), 7.54 (s, 1H)
_	1401		1.80-1.95 (m, 2H), 2.05-2.25 (m, 2H), 2.35-2.60 (m, 4H), 2.63-2.81 (m, 2H), 3.25-3.55 (m, 6H), 3.85-4.25 (m, 6H), 5.09 (s, 2H), 7.20-7.40 (m, 4H), 7.54 (s, 1H)

表76

10

_	実施例	R1	R2	R3 R4	R5	R6	mp(°C)
	1402	-H	-H	-H -CI	-H	-H	249 - 252(dec.)
	1403	-H	-H	-H -F	-H	-H	238 - 240(dec.)
	1404	-H	-H	-H -CF₃	-H	-H	215 - 217
	1405	-H	-H	-H -OCF₃	-H	-H	231 - 233
	1406	-H	-H	-н -сн₃	-H	-H	>300
	1407	-H	-H	-F Morpholino-	-H	-H	240 - 245(dec.)
	1408	-H	-H	-H -CO ₂ C(CH ₃) ₃	-H	-H	>300
	1409	-H	-н	-CI —N N-CH ₃	-Н	-H	205 - 207
	1410	-H	-н	-H —N N-CH ₃	-Н	-н	246 - 250(dec.)
	1411	-Н	-н	-F —N N-CH ₃	-H	-н	220 - 225(dec.)

	実施例 R1	Mp(°C)
	1412 PhCO-	178-180
•	1413 PhCH ₂ CO-	170-171
90	1414 Ph(CH ₂) ₂ CO-	160.5-162
20	1415 PhOCH ₂ CO-	203-205
	1416 (CH ₃) ₂ CHCH ₂ CO-	214-215
	1417 4-CF₃PhCO-	165-166
	1418 PhCH ₂ -	249-251 (dec.)
	1419 4-PhPhCH₂-	262-264(dec.)
	1420	195-197(dec.)
25	1421 N	226-227(dec.)

- (S) -1-(2-ブロモー4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-メチル -3-{4-[1-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペリジン-4-イル] ピペラジン-1-イル} プロパン-2-オールの製造
- 5 (R) -2-ブロモー4-ニトロー1-(2-メチルー2-オキシラニルメチル)イミダゾール(485mg、1.75mmol)、1-[1-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペリジン-4-イル]ピペラジン(720mg、2.19mmol)、およびエタノール(10ml)の混合物を50℃にて8時間攪拌した。反応液を濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メ
- 10 チレン/メタノール=20/1)により精製し、黄色アモルファスの(S)-1 -(2-プロモー4-ニトロイミダゾールー1-イル)-2-メチルー3- {4 -[1-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペリジン-4-イル] ピペラジン-1-イル} プロパン-2-オール(792mg、収率77%)を得た。 1 H-NMR(CDC 1 $_3$) δ $_{\rm P}$ $_{\rm P}$ $_{\rm M}$
- 15 1. 13 (3H, s), 1. 50-1. 75 (2H, m), 1. 81-2. 00 (2H, m), 2. 35 (1H, d, J=13. 9Hz), 2. 40-2. 86 (12H, m), 3. 57-3. 76 (2H, m), 3. 98 (2H, s), 6. 89 (2H, d, J=8. 5Hz), 7. 09 (2H, d, J=8. 5Hz), 8. 12 (1H, s).
- 20 同様の方法により、以下の化合物を製造した。

- 25 ¹H-NMR (CDCl₃) δ p p m 1. 12 (3H, s), 1. 29-1. 48 (11H, m), 1. 67-1. 8 1 (2H, m), 2. 34 (1H, d, J=13. 8Hz), 2. 38-2. 7 4 (12H, m), 3. 97 (2H, s), 4. 02-4. 14 (2H, m), 8. 05 (1H, s).

- 5 ¹H-NMR (CDCl₃) δ p p m 1. 11 (3H, s), 1. 38-1. 57 (11H, m), 1. 69-1. 8 6 (2H, m), 2. 24-2. 50 (9H, m), 2. 67-2. 79 (1H, m), 2. 86-3. 00 (1H, m), 3. 31-3. 43 (4H, m), 3. 95 (2H, s), 8. 04 (1H, s).

表78

実施例	X	R	¹H-NMR (CDC1 ₃) δ ppm
1425	none	OCF ₃	1. 13 (3H, s), 1. 50-1. 75 (2H, m), 1. 81-2. 00 (2H, m), 2. 35 (1H, d, J=13. 9Hz), 2. 40-2. 86 (12H, m), 3. 57-3. 76 (2H, m), 3. 98 (2H, s), 6. 89 (2H, d, J=8. 5Hz), 7. 09 (2H, d, J=8. 5Hz), 8. 12 (1H, s).
1426	C=O	Cl	1.13(3H, s), 1.31-1.56(2H, m), 1.70-2.00(2H, m), 2.36(1H, d, J=13.9Hz), 2.65-2.91(12H, m), 3.63-3.84(1H, m), 3.93(2H, s), 4.56-4.74(1H, m), 7.19-7.42(4H, m), 8.13(1H, s).
1427	C=0	OCF ₃	1. 14(3H, s), 1. 35-1. 60(2H, m), 1. 74-2. 00(2H, m), 2. 36(1H, d, J=13. 9Hz), 2. 42-2. 93(12H, m), 3. 65-3. 81(1H, m), 4. 00(2H, s), 4. 56-4. 74(1H, m), 7. 25(2H, d, J=8. 7Hz), 7. 44(2H, d, J=8. 7Hz), 8. 14(1H, s).
1428	CH ₂	C1	1.12(3H, s), 1.43-2.05(6H, m), 2.34(1H, d, J=13.9Hz), 2.37-2.95(12H, m), 3.47(2H, s), 3.97(2H, s), 7.12-7.30(4H, m), 8.12(1H, s).
1429	CH ₂	OCF ₃	1. 12 (3H, s), 1. 44-2. 05 (6H, m), 2. 35 (1H, d, J=14. 0Hz), 2. 42-2. 93 (12H, m), 3. 48 (2H, s), 3. 98 (2H, s), 7. 15 (2H, d, J=8. 6Hz), 7. 34 (2H, d, J=8. 6Hz), 8. 12 (1H, s).

表79

実施例	Х	R	¹H-NMR (CDCl ₃) δ ppm
1430	C=0	C1	1.12(3H, s), 1.43-1.81(4H, m), 2.10-2.62(9H, m), 2.71-3.07(2H, m), 3.31-3.45(4H, m), 3.96(2H, s), 7.24-7.40(4H, m), 8.10(1H, s).
1431	C=0	OCF ₃	1.12(3H, s), 1.45-1.83(4H, m), 2.12-2.57(9H, m), 2.71-3.07(2H, m), 3.28-3.47(4H, m), 3.96(2H, s), 7.25(2H, d, J=8.6Hz), 7.45(2H, d, J=8.6Hz), 8.10(1H, s).
1432	CH ₂	OCF ₃	1.11(3H, s), 1.50-1.98(4H, m), 2.24-3.10(15H, m), 3.54(2H, s), 3.98(2H, s), 7.16(2H, d, J=8.6Hz), 7.34(2H, d, J=8.6Hz), 8.12(1H, s).
1433	CH ₂	C1	1.11(3H, s), 1.40-1.83(4H, m), 2.25-3.02(15H, m), 3.46(2H, s), 3.95(2H, s), 7.14-7.29(4H, m), 8.12(1H, s).
1434	none	OCF ₃	1.13(3H, s), 1.50-1.64(2H, m), 1,76-1.88(2H, m), 2.15-2.43(5H, m), 2.52-2.95(6H, m), 3.05-3.19(4H, m), 3.98(2H, s), 6.89(2H, d, J=8.7Hz), 7.11(2H, d, J=8.7Hz), 8.1 (1H, s).
1435	none	C1	1.13(3H, s), 1.50-1.64(2H, m), 1,71-1.90(2H, m), 2.12-2.48(5H, m), 2.55-2.90(6H, m), 3.05-3.19(4H, m), 3.96(2H, s), 6.84(2H, d, J=8.7Hz), 7.18(2H, d, J=8.7Hz), 8.11(1H, s).

表80

$$0 - N_{N}^{+}$$

-	実施例	Х	R	¹ H-NMP (CDC1) \$		
	1436	C1	4C1Ph-	¹ H-NMR (CDC1 ₃) δ ppm 1. 17 (3H, s), 2. 41 (1H, d, J=13. 9Hz), 2. 56 (1H, d, J=13. 9Hz), 2. 63-2. 73 (2H, m), 2. 76-2. 92 (2H, m), 3. 08-3. 18 (4H, m), 3. 40 (1H, s), 4. 01 (2H, s), 6. 80-6. 96 (6H, m), 7. 14-7. 24 (2H, m), 8. 06 (1H, s).		
	1437	Br	4- CF ₃ PhCH ₂ -	1. 16 (3H, s), 2. 39 (1H, d, J=13. 9Hz), 2. 55 (1H, d, J=13. 9Hz), 2. 65-2. 78 (2H, m), 2. 84-2. 92 (2H, m), 3. 02-3. 14 (4H, m), 3. 46 (1H, s), 4. 01 (2H, s), 5. 08 (2H, s), 6. 89 (4H, m), 7. 48 (2H, d, J=8. 3Hz), 7. 63 (2H, d, J=8. 3Hz), 8. 12 (1H, s).		
	1438	Br	4- C1PhCH ₂ -	1. 16 (3H, s), 2. 39 (1H, d, J=13. 9Hz), 2. 55 (1H, d, J=13. 9Hz), 2. 63-2. 78 (2H, m), 2. 80-2. 96 (2H, m), 3. 04-3. 12 (4H, m), 3. 47 (1H, s), 4. 01 (2H, s), 4. 98 (2H, s), 6. 88 (4H, s), 7. 35 (4H, s), 8. 12 (1H, s).		
]	439	C1	4- CF ₃ OPhCH ₂ -	1. 16 (3H, s), 2. 40 (1H, d, J=13. 9Hz), 2. 55 (1H, d, J=13. 9Hz), 2. 65-2. 76 (2H, m), 2. 78-2. 92 (2H, m), 3. 04-3. 12 (4H, m), 3. 45 (1H, s), 4. 00 (2H, s), 5. 0 (2H, s), 6. 89 (4H, s), 7. 22 (2H, d, J=8. 6Hz), 7. 45 (2H, d, J=8. 6Hz), 8. 06 (1H, s).		
1	440	C1	4-CF ₃ 0Ph-	1. 18 (3H, s), 2. 41 (1H, d, J=13. 9Hz), 2. 56 (1H, d, J=13. 9Hz), 2. 65-2. 76 (2H, m), 2. 78-2. 88 (2H, m), 3. 06-3. 20 (4H, m), 3. 39 (1H, s), 4. 02 (2H, s), 6. 84-7. 00 (6H, m), 7. 14 (2H, d, J=8. 3Hz), 8. 06 (1H, s).		
1.	441	C1		1. 18 (3H, s), 2. 42 (1H, d, J=13. 9Hz), 2. 57 (1H, d, J=13. 9Hz), 2. 65-2. 77 (2H, m), 2. 79-2. 92 (2H, m), 3. 06-3. 20 (4H, m), 3. 40 (1H, s), 4. 03 (2H, s), 6. 80-7. 00 (6H, m), 7. 53 (2H, d, J=8. 6Hz), 8. 07 (1H, s).		

表81

$$0 - N_{\downarrow}^{\downarrow}$$

$$0 - N_{\downarrow}$$

$$0 -$$

実施例	R	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ ppm			
1442	C1-	1.17(3H, s), 2.40(1H, d, J=13.9Hz), 2.55(1H, d, J=13.9Hz), 2.65-2.92(4H, m), 3.08-3.24(4H, m), 3.40(2H, s), 4.00(2H, s), 4.20(2H, s), 6.54(2H, d, J=8.7Hz), 6.88(2H, d, J=8.7Hz), 7.09(2H, d, J=8.7Hz), 7.18-7.25(2H, m), 8.06(1H, s).			
1443	CF₃0−	1.16(3H, s), 2.41(1H, d, J=13.9Hz), 2.55(1H, d, J=13.9Hz), 2.65-2.92(4H, m), 3.08-3.25(4H, m), 3.44(2H, s), 4.02(2H, s), 4.21(2H, s), 6.57(2H, d, J=8.6Hz), 6.89(2H, d, J=8.6Hz), 7.01(2H, d, J=8.3Hz), 7.22(2H, d, J=8.3Hz), 8.06(1H, s).			

表82

実施例	X	D	Try are con con
一大儿的	A	R	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ ppm
			1.15(3H, s), 1.51-1.86(4H, m), 2.27-
1444	Cl		2.57(3H, m), 2.75-2.92(2H, m), 3.00-
1444		CF ₃	3.16(2H, m), 3.56(1H, s), 4.17(2H, s),
	Ì		6.90-7.02(4H, m), 7.10-7.25(2H, m),
	 -		7.56(2H, d, J=8.8Hz), 8.01(1H, s).
			1.25(3H, s), 1.50-2.00(8H, m), 2.24-
1445	Br	-N 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0	2.67(7H, m), 2.75-3.20(4H, m), 3.97(2H,
0		N OCF3	s), 4.25-4.40(1H, m), 6.88(2H, d,
			J=8.8Hz), 7.13(2H, d, J=8.8Hz), 8.12(1H,
	1		s).
		Q	1.14(3H, s), 1.76-1.93(4H, m), 2.24-
1446	Cl		2.52(5H, m), 2.74-2.86(1H, m), 2.95-
		N—OCF ₃	3.07(1H, m), 3.98(2H, s), 7.17(2H, d,
	1	" 🛫	J=8.8Hz), 7.55(2H, d, J=8.8Hz), 8.05(1H,
			s).
ĺ	Cl	N———ocf,	1.13(3H, s), 1.51-1.90(4H, m), 2.19-
1447			2.55(5H, m), 2.71-2.83(1H, m), 2.85-
			3.19(5H, m), 3.51-3.83(4H, m), 3.98(2H,
			s), 6.90(2H, d, J=8.3Hz), 7.13(2H, d, J=8.3Hz), 8.05(1H, s).
		H ₂ N	1.15(3H, s), 1.39-1.83(5H, m), 2.33-
	1 .		2.62(3H, m), 3.00-3.15(2H, m), 3.49-
1448	Cl	N CI	3.61(2H, m), 4.17(2H, s), 6.97-7.05(4H,
		V _N .	m), 7.21-7.24(2H, m), 7.53-7.58(2H, m),
			8.08(1H, s)
			1.14(3H, s), 1.61-1.81(5H, m), 2.34-
			2.57(3H, m), 2.77-2.84(2H, m), 3.01-
1449	Cl		3.06(2H, m), 3.99(2H, s), 5.04(2H, s),
			6.89-6.95(2H, m), 7.11-7.25(4H, m), 7.43-
			7.48(2H, m), 8.09(1H, s)
			1.14(3H, s), 1.45-1.80(5H, m), 2.38-
			2.60(3H, m), 2.78-2.90(2H, m), 3.01-
1450	Cl		3.06(2H, m), 3.98(2H, s), 5.11(2H, s),
. ,00	01	CF ₃	6.89-6.93(2H, m), 7.12-7.18(2H, m), 7.52-
	İ		7.55(2H, m), 7.62-7.65(2H, m), 8.08(1H,
			s)
			1.14(3H, s), 1.38-1.80(5H, m), 2.28-
			2.60(3H, m), 2.77-2.93(2H, m), 3.02-
1451	Cl	— »-o ~ »-cı	3.08(2H, m), 3.98(2H, s), 5.01(2H, s),
			6.84-6.92(2H, m), 7.11-7.16(2H, m), 7.32-
			7.36(4H, m), 8.08(1H, s)
			7.50(411, 111), 0.00(111, S)

表83

実施例	R1	R2	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ ppm
1452	_NN0	СН3	1. 13 (3H, s), 1. 48 (9H, s), 2. 42 (3H, s), 2. 43 (2H, s), 3. 03-3. 13 (4H, m), 3. 42 (1H, d, J=10.7Hz), 3. 50-3. 63 (5H, m), 3. 85 (2H, s), 6. 84 (2H, d, J=7. 1Hz), 7. 11 (2H, d, J=7. 1Hz), 7. 88 (1H, s).
1453		C₂H₅	1.06-1.11(6H, m), 1.48(9H, s), 2.41(1H, d, J=13.2Hz), 2.55(1H, d, J=13.2Hz), 2.64-2.68(2H, m), 3.10- 3.13(4H, m), 3.42(1H, d, J=13.2Hz), 3.57-3.60(4H, m), 3.69(1H, d, J=13.2Hz), 3.79(2H, s), 6.83- 6.86(2H, m), 7.09-7.12(2H, m), 7.84(1H, s).

- 5 (S) -2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-$ [1- (4-トリフルオロメト キシフェニル)ピペリジン-4-イル] ピペラジン-1-イルメチル $\}-2$, 3 -ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造
- (S) -1-(2-ブロモー4-ニトロイミダゾールー1ーイル) -2ーメチル-3- {4-[1-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペリジンー4-10 イル] ピペラジンー1ーイル} プロパンー2ーオール (790mg、1.34 mmol)をN, Nージメチルホルムアミド(4ml)に溶解し、氷冷下にて水素化ナトリウム(69mg、1.74mmol)を加え、同温度下にて1時間攪拌した。反応液に酢酸エチル(1.3ml)、水(10ml)の順に加え、析出晶を濾取し、水洗した。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=10/1)により精製後、酢酸エチル/イソプロピルエーテルから再結晶することにより白色粉末の(S) -2ーメチルー6ーニトロー2ー {4-[1-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペリジンー4ーイル] ピ

ペラジン-1-イルメチル $}$ -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール $(270 \text{mg} \times \text{収率} 40\%)$ を得た。

融点 180-181.5℃

実施例1455

収率 34%

融点 226-228℃

- 10 実施例1456

収率 23%

15 融点 193-194℃

実施例1457

- 20 収率 25%

融点 148-149℃

実施例1458

- (S) -2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-$ [4-(4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペラジン-1-イル] ピペリジン-1-イルメチル $\}-2$ 、3
- 25 ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

収率 21%

融点 142-143℃

実施例1459

(S) - (4-クロロフェニル) - {4-[1-(2-メチル-6-ニトロー

2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2-イルメチル) l l

収率 29%

融点 174-175℃

- 5 実施例1460
 - $(S) \{4-[1-(2-メチル-6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル) ピペリジンー4ーイル] ピペラジンー<math>1-$ イル $\} (4-$ トリフルオロメトキシフェニル) メタノン

収率 29%

10 融点 137-138℃

実施例1461

- (S) $-2-\{4-[1-(4-\rho uu べンジル) ピペリジン-4-イル] ピペラジン-1-イルメチル\} -2-メチル-6-ニトロ-2, <math>3-$ ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール
- 15 収率 24%

融点 168-169℃

実施例1462

- (S) -2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-[1-(4-$ トリフルオロメトキシベンジル) ピペリジン-4-イル] ピペラジン-1-イルメチル $\}-2$, 3
- 20 ージヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

収率 27%

融点 140-141℃

実施例1463

(S) - (4-クロロフェニル) - {4- [4- (2-メチル-6-ニトロー

25 2, 3 – ジヒドロイミダゾ [2, 1 – b] オキサゾールー 2 – イルメチル) ピペ ラジン- 1 – イル] ピペリジン- 1 – イル} メタノン

収率 30%

融点 218-220℃

- (S) $-\{4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル) ピペラジンー<math>1-イル$] ピペリジンー $1-イル\}$ (4-トリフルオロメトキシフェニル) メタノン 収率 27%
- 5 融点 133-134℃

- 10 収率 41%

15

融点 131-132℃

- (R) -2-クロロー4-ニトロー1- (2-メチル-2-オキシラニルメチル) イミダゾール (3g、13.79mmol)、4-ピペラジン-1-イルーピペリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル (3.9g、14.48mmol)、およびエタノール (30ml) の混合物を50℃にて9時間攪拌し
- 20 た。反応液を濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=10/1)により精製し、黄色アモルファスを得た。これをN, Nージメチルホルムアミド(18m1)に溶解し、氷冷下にて水素化ナトリウム(651mg、16.28mmo1)を加え、同温度下にて1時間攪拌した。反応液に酢酸エチル(6m1)、水(42m1)の順に加え、析出晶を濾取し、水
- 25 洗した。これを2-プロパノール(20ml)/水(60ml)から再結晶することにより微黄色粉末の(S)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]ピペリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(4.08g、66%)を得た。

融点 181-182℃

同様の方法により、以下の化合物を製造した。

実施例1467

(S) -4-[1-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ

5 [2, 1-b] オキサゾールー 2 ーイルメチル) ピペリジンー 4 ーイル] ピペラジンー 1 ーカルボン酸 t e r t ーブチルエステル

収率 56%

融点 184-185℃

- 10 (S) -4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル] ピペリジン-1-カルボン酸4-トリフルオロメトキシベンジルエステルの製造
 4-(トリフルオロメトキシ) ベンジルアルコール (480mg、2.50
 - mmol)、1,1' -カルボニルビス-1 $\mathrm{H}-$ イミダゾール(405 mg 、2.
- 15 50mmol)、およびN, Nージメチルホルムアミド(3ml)の混合物を室 温下にて14時間攪拌した。
- 20 mmo1)を塩化メチレン(5m1)に溶解し、トリフルオロ酢酸(5m1)を加え、室温下にて14時間攪拌した。この反応液を濃縮し、残渣にメタノール(5m1)、トリエチルアミン(5m1)を加え、室温下にて10分攪拌後、濃縮した。残渣をN,N-ジメチルホルムアミド(<math>5m1)に溶解し、これを先程のN,N-ジメチルホルムアミド溶液に加え、<math>50 Cにて3時間攪拌した。
- 25 反応液を室温に戻し、水(40m1)中に注ぎ、酢酸エチル(30m1)により2回抽出した。有機相を合わせ、水(40m1)により2回洗浄後、飽和食塩水(30m1)により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。濾過後、濾液を濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=10/1)により精製後、酢酸エチル/イソプロピルエーテルから再結晶す

ることにより淡茶粉末の(S)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロー2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾールー2ーイルメチル)ピペラジン-1-イル] ピペリジン-1-カルボン酸 4-トリフルオロメトキシベンジルエステル(545mg、58%)を得た。

5 融点 105-106℃

同様の方法により、以下の化合物を製造した。

実施例1469

(S) -4-[1-(2-メチルー6-ニトロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールー2ーイルメチル) ピペリジンー<math>4-イル] ピペラ

10 ジン-1-カルボン酸4-トリフルオロメトキシベンジルエステル

収率 64%

融点 110-111℃

- (S) -2-メチル-6-ニトロ-2- [4-{1-[3-(4-トリフルオ 15 ロメトキシフェニル) -2-プロペニル] ピペリジン-4-イル} ピペラジン-1-イルメチル] -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製 造
 - (S) -4-[4-(2-メチルー6-ニトロー2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾールー2ーイルメチル)ピペラジンー<math>1-4ル]ピペリ
- 20 ジン-1-カルボン酸 t e r t ブチルエステル (750 mg、1.66 mm o 1) を塩化メチレン (5 m 1) に溶解し、トリフルオロ酢酸 (5 m 1) を加え、室温下にて1.5時間攪拌した。この反応液を濃縮し、残渣に塩化メチレン (5 m 1)、トリエチルアミン (5 m 1)を加え、室温下にて10分攪拌後、濃縮した。残渣を1,2-ジクロロエタン (20 m 1)に溶解し、3-(4-ト25 リフルオロメトキシフェニル)プロペナール (396 mg、1.83 mm o 1)、トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム (564 mg、2.66 mm o 1)を加え、室温下にて3.5時間攪拌した。反応液を飽和重曹水 (15 m 1)、水 (20 m 1)、飽和食塩水 (20 m 1)の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。濾過後、濾液を濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化

メチレン/メタノール=10/1)により精製後、メタノール/水から再結晶することにより微黄色粉末の(S)-2-メチル-6-ニトロ-2-[4-{1-[3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-2-プロペニル] ピペリジン-4-イル} ピペラジン-1-イルメチル] -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール(446 mg、49%)を得た。

融点 157-158℃

同様の方法により、以下の化合物を製造した。

実施例1471

(S) -2-メチル-6-ニトロ-2- [4-{4-[3-(4-トリフルオ 10 ロメトキシフェニル) -2-プロペニル] ピペラジン-1-イル} ピペリジン-1-イルメチル] -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール 融点 174-175℃

実施例1472

(S) -2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-$ [4-(4-トリフルオロメト 15 キシフェノキシ) フェニル] ピペラジン-1-イルメチル $\}-2$, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール4-トルエンスルホン酸塩

融点 146.1-148.6℃

実施例1473

(S) -2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-$ [4-(4-トリフルオロメトキ 20 シフェノキシ) フェニル] ピペラジン-1-イルメチル $\}-2$, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール塩酸塩

融点 133-137℃

表84

実施例	R1	R2	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ ppm
1474	O CH ₃ CH ₃ CH ₃	CH ₃	1. 48 (9H, s), 1. 55 (3H, s), 2. 36 (3H, s), 2. 61 (1H, d, J=12. 3Hz), 2. 80 (1H, d, J=12. 3Hz), 3. 03-3. 15 (4H, m), 3. 41 (1H, d, J=10. 8Hz), 3. 48-3. 60 (5H, m), 3. 69 (1H, d, J=8. 1Hz), 4. 08 (1H, d, J=8. 1Hz), 6. 85 (2H, d, J=7. 1Hz), 7. 06 (2H, d, J=7. 1Hz), 7. 46 (1H, s).
1475	O CH ₃ CH ₃ CH ₃	C ₂ H ₅	0.97(3H, t, J=7.1Hz), 1.49(9H, s), 1.53(3H, s), 2.54-2.78(3H, m), 2.93- 2.96(1H, m), 3.10-3.13(4H, m), 3.39- 3.43(1H, m), 3.57-3.67(6H, m), 3.96(1H, d, J=9.8Hz), 6.83-6.85(2H, m), 7.02-7.05(2H, m), 7.43(1H, s).
1476	Н	СН₃	1.53(3H, s), 2.37(3H, s), 2.60(1H, d, J=12.2Hz), 2.78(1H, d, J=12.2Hz), 2.98-3.18(8H, m), 3.40(1H, d, J=10.8Hz), 3.55(1H, d, J=10.8Hz), 3.66(1H, d, J=8.1Hz), 4.04(1H, d, J=8.1Hz), 6.85(2H, d, J=7.1Hz), 7.06(2H, d, J=7.1Hz), 7.45(1H, s).
1477	Н	C₂H₅	0.98(3H, t, J=7.1Hz), 1.53(3H, s), 2.55-2.75(3H, m), 2.93-2.95(1H, m), 3.15-3.18(4H, m), 3.24-3.28(4H, m), 3.37-3.43(1H, m), 3.62-3.67(2H, m), 3.94(1H, d, J=9.8Hz), 6.82-6.87(2H, m), 7.02-7.05(2H, m), 7.44(1H, s).

表85

$$NO_2$$
 NO_2
 NO_2
 NO_2
 NO_2
 NO_2

実施例	R1	R2	mp (℃)
1478	-CH ₃	4-C1Ph-	202.6 - 204.0 dec
1479	$-CH_3$	4-CF ₃ PhCH ₂ -	172.0 - 174.2
1480	$-CH_3$	4-C1PhCH ₂ -	227.0 - 228.3 dec
1481	$-CH_3$	4 – $\mathrm{CF_3OPhCH_2}$ –	176 - 179.5
1482	$-CH_3$	4-CF ₃ OPh-	114.1 - 116.6
1483	$-CH_3$	4-CF ₃ Ph-	105 - 110

実施例	R1	R2	R3	mp (℃)
1484	-CH ₃	-CH ₃	4-C1Ph-	126. 2-127. 5
1485	$-CH_3$	$-CH_3$	4-CF ₃ OPh-	103. 0-106. 6
1486	$-CH_3$	-H	4-C1Ph-	209.8 - 210.3 dec
1487	−CH ₃	-H	4-CF ₃ OPh-	110.0 - 113.5

表87

実施例	R1	R2	mp(°C) or ¹H NMR
1488	$-\mathrm{CH_3}$	F F F	110.6-111.7
1489	-CH_3	O F F	¹ H NMR(CDCl ₃) □ppm 1.56- 1.71(7H, m), 2.16(3H, m), 2.57(1H, d, J=14.9Hz), 2.76- 3.10(3H, m), 3.93(1H, d, J=9.8Hz), 4.36(1H, d, J=9.8Hz), 7.12(2H, d, J=8.5Hz), 7.55- 7.68(3H, m), 9.04(1H, s).
1490	-CH ₃	$\bigcup_{N} \bigcup_{N} \bigcup_{F} F$	¹ H NMR(CDCl ₃) □ppm 1.48- 1.68(4H, m), 1.75-1.95(1H, m), 2.19-2.56(4H, m), 2.75-3.19(9H, m), 3.53-3.77(4H, m), 3.88(1H, d, J=9.7Hz), 4.36(1H, d, J=9.7Hz), 6.89(2H, d, J=8.5Hz), 7.13(2H, d, J=8.5Hz), 7.68(1H, s).
1491	$-\mathrm{CH_3}$	TO FF	148.4 - 149.7
1492	$-\mathrm{CH_3}$	0 FF	160.4-161.8
1493	$-\mathrm{CH_3}$	CI CI	164.4 – 167.3 dec
1494	$-\mathrm{CH_3}$	N F F	140.2-142.8

表88

実施例	R1	R2	R3	mp(°C) or ¹H NMR
1495	-СН ₃	N N CI -	СН3	143.1 - 145.8
1496	-СН ₃	N N CI -	C_2H_5	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 0.97 (3H, t, J=7.1Hz), 1.51 (3H, s), 2.58-2.76 (7H, m), 2.89 (1H, d, J=14.9Hz), 3.17-3.20 (4H, m), 3.38 (1H, d, J=13.3Hz), 3.54-3.64 (4H, m), 3.89 (1H, d, J=9.8Hz), 6.82-6.85 (2H, m), 7.01-7.04 (2H, m), 7.27-7.30 (4H, m), 7.41 (1H, s).
1497	-СН ₃	H ₃ C CI -	-СН3	100.7 - 103.0

実施例649と同様にして以下の化合物を製造した。

表89

$$0 \xrightarrow[]{N^+} N \xrightarrow[]{H0} N \xrightarrow[]{C1}$$

実施例	R	Solvent	¹H-NMR δ ppm
1498	-C1	DMSO-d ₆	1. 32-1. 50 (2H, m), 1. 55-1. 75 (2H, m), 2. 86-3. 02 (2H, m), 3. 36-3. 50 (2H, m), 4. 05 (2H, s), 4. 93 (1H, s), 6. 95 (2H, d, J=8. 9Hz), 7. 21 (2H, d, J=8. 9Hz), 8. 35 (1H, s).
1499	−0CF ₃	DMSO-d ₆	1.51-1.67(2H, m), 1.76-1.94(2H, m), 2.02(1H, s), 2.96-3.12(2H, m), 3.37-3.56(2H, m), 4.07(2H, s), 6.9(2H, d, J=8.9Hz), 7.12(2H, d, J=8.9Hz), 8.00(1H, s).
1500	CH ₃ OCF ₃	CDC1 ₃	1.57-1.71(2H, m), 1.78-1.98(2H, m), 2.92-3.08(2H, m), 3.24(3H, s), 3.35-3.51(2H, m), 4.09(2H, s), 6.74(2H, d, J=8.9Hz), 6.88-7.10(6H, m), 8.02(1H, s).
1501		CDC1 ₃	1.55-1.69(2H, m), 1.80-1.98(2H, m), 2.92-3.08(2H, m), 3.33-3.49(2H, m), 4.09(2H, s), 6.82-6.98(6H, m), 7.14(2H, d, J=8.9Hz), 8.02(1H, s).
1502	-N_0-0CF ₃	CDC1 ₃	1.53-1.67(2H, m), 1.80-2.16(6H, m), 2.84-3.06(4H, m), 3.24-3.45(4H, m), 4.11(2H, s), 4.33-4.47(1H, m), 6.80-6.92(6H, m), 7.14(2H, d, J=8.9Hz), 8.00(1H, s).
1503	N——OCF ₃	CDC1 ₃	1. 53-1. 65 (2H, m), 1. 82-1. 98 (2H, m), 2. 84-3. 00 (2H, m), 3. 14-3. 39 (10 H, m), 4. 07 (2H, s), 6. 84-6. 96 (6H, m), 7. 14 (2H, d, J=8. 6Hz), 8. 01 (1H, s).

実施例652と同様にして以下の化合物を製造した。

表90

実施例	R1	mp(℃)
1504	-C1	242.0 - 245.0
1505	-OCF ₃	235.9 - 236.8dec.
1506	H ₃ C. F	214.0 - 215.1dec.
1507	0	227. 3-229. 4
1508	0 F 0 F F	237. 6-238. 4
1509	-N N 0 F F	254. 2 - 256. 8

5 実施例128と同様にして以下の化合物を製造した。

実施例1510

10 融点 186-188℃

実施例1511

15 融点 157-160℃

(R) -2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-$ [3-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) -8-アザビシクロ[3.2.1] オクタン-8-イル] フェノキシメチル $\}-2$, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b] オキサゾール4-トルエンスルホン酸塩

5 融点 207. 2-208. 0℃dec

実施例1513

2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ベンジルオキシメチル] -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

10 融点107.9-109.3℃

実施例1514

6-ニトロ-2- $\{4-$ [4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェノキシメチル $\}-2$, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1- b] オキサゾール

15 融点 173.2-177.3℃

実施例1515

2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-$ [4- (4-クロロフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェノキシメチル $\}-2$, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1- b] オキサゾール

20 融点 151.0-152.3℃

実施例1516

(S) -2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-$ [4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェノキシメチル $\}-2$, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

25 融点; 199.0-200.5℃

表91

実施例	R1	R2	mp (°C)
1517	-CH ₃	-C1	183.8 - 184
1518	-CH ₃	-CF ₃	179. 4 - 180. 9
1519	$-CH_3$	-F	190. 2 - 192. 8
1520	$-CH^3$	-OCH3	193. 3 - 194. 5
1521	$-CH_3$	$-CH_3$	198.2 - 201.1 dec
1522	$-CH^3$	-H	194. 5 - 197. 5
1523	$-CH_3$	CN	196.2 - 198.5 dec
1524	-H	-OCF ₃	157.0 - 160.0
1525	-H	-C1	166.5 - 171.0 dec
			and the second s

表92

実施例						···········	
	R1	R2	R3	R4	R5	R6	MS(M+1)
1526	$-CH_3$	-OCH ₃	-H	-H	-H	-H	481
1527	$-CH_3$	-H	$-OCH_3$	-H	-H	-H	481
1528	$-CH_3$	-H	-H	$-OCH_3$	-H	-H	481
1529	$-CH_3$	-H	-H	-H	$-OCH_3$	-OCH ₃	511
1530	$-CH_3$	$-OCH_3$	-H	-H	-H	-OCH ₃	511
1531	$-CH_3$	-H	-H	$-\mathrm{OCH_3}$	$-OCH_3$	-H	511
1532	$-CH_3$	- H	$-OCH_3$	-H	$-OCH_3$	-H	511
1533	$-CH_3$	-H	-H	-H	-H	-H	451
1534	$-CH_3$	-H	-H	-H	-H	-Cl	485
1535	$-CH_3$	-H	-H	-H	-C1	-H	485
1536	$-CH_3$	-H	-H	-Cl	-H	-H	485
1537	$-CH_3$	-Cl	-Cl	-H	-H	-H	519
1538	$-CH_3$	-C1	-H	-Cl	-H	-H	519
1539	$-CH_3$	-C1	-H	-H	-Cl	-H	519
1540	$-CH_3$	-Cl	-H	-H	-H	-Cl	519
1541	$-CH_3$	-H	-Cl	-Cl	-H	-H	519
1542	$-CH_3$	-H	-Cl	-H	-Cl	-H	519
1543	$-CH_3$	-H	-H	-H	-H	$-CH_3$	465
1544	$-CH_3$	-H	-H	-H	$-CH_3$	-H	465
1545	$-CH_3$	-H	-H	$-\mathrm{CH_3}$	-H	-H	465
1546	$-CH_3$	$-CH_3$	$-\mathrm{CH_3}$	-H	-H	-H	479
1547	$-CH_3$	$-CH_3$	-H	$-\mathrm{CH_3}$	-H	-H	479
1548	$-CH_3$	$-CH_3$	-H	-H	$-CH_3$	-H	479
1549	$-CH_3$	$-CH_3$	-H	-H	-H	$-CH_3$	479
1550	$-CH_3$	-H	$-\mathrm{CH_3}$	$-\mathrm{CH_3}$	-H	-H	479
1551	$-CH_3$	-H	$-\mathrm{CH_3}$	-H	$-CH_3$	-H	479
1552	$-CH_3$	-H	-H	-H	-H	-F	469
1553	$-CH_3$	-H	-H	-H	-F	-H	469
1554	$-CH_3$	-H	-H	-F	-H	-H	469
1555	$-CH_3$	-F	-F	-H	-H	-H	487
1556	$-CH_3$	-F	-H	-F	-H	-H	487
1557	$-CH_3$	-F	-H	-H	-F	-H	487
1558	$-CH_3$	-F	-H	-H	-H	- F	487
1559	$-CH_3$	-H	- F	- F	-H	-H	487
1560	$-CH_3$	$-CO_2C_2H_5$	-H	-H	-H	-H	523
1561	-CH₃	-H	$-\mathrm{CO_2C_2H_5}$	-H	-H	-H	523
1562	-CH ₃	-H	-H	$-CO_2C_2H_5$	-H	-H	523
1563	-CH ₃	-CN	-H	-H	-H	-H	476
1564	-CH ₃	-H	-CN	-H	-H	-H	476
1565	-CH ₃	-H	-H	-CN	-H	-H	476
1566	$-CH_3$	-H	-H	-H	-H	-CF ₃	519
	-CH ₃	-H	-H	-H	-CF ₃	-H	519

表93

実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	MS (M+1)
1568	-CH ₃	-H	-H	-CF ₃	-Н	-Н	519
1569	-CH ₃	-Н	-Н	-Н	-Н	-OCF ₃	535
1570	-CH ₃	-Н	-F	-Н	-F	-Н	487
1571	−CH ₃	-H	-Н	-Н	-OCF ₃	-Н	535
1572	$-CH_3$	−H	-H	-OCF ₃	-H	Н	535
1573	$-CH_3$	-H	− H	-H	-H	$-$ 0CH (CH $_3$) $_2$	509
1574	$-CH_3$	-H	-H	-CH ₃	-H	$-CO_2C_2H_5$	537
1575	$-CH_3$	-H	-H	-OCH ₃	-H	-CO ₂ CH ₃	539
1576	$-CH_3$	-H	-H	-Br	-H	-F	547
1577	$-CH_3$	-H	-CH ₃	-Н	-H	-F	483
1578	$-CH_3$	-Н	-H	-СЗН7	~H	—H	493
1579	$-CH_3$	-H	-H	-C1	-F	-H	503
1580	$-CH_3$	-Н	-H	$-NO_2$	-Н	− F	514
1581	$-CH_3$	-H	-H	$-CH_2CH=CH_2$	− H .	-OCH ₃	521
1582	$-CH_3$	-H	-Н	-H	$-C_6H_5$	− H	527
1583	-СНЗ	-Н	-Н	-Н	$-N(C_2H_5)_2$	-H	522
1584	-СН3	-Н	-CH=CHCH $_3$ (cis)	-H	H	$-0C_{2}H_{5}$	535
1585	$-CH_3$	-H	-Н	-CH (CH ₃) ₂	-H	−H	493
1586	$-CH_3$	-H	H	-H	-NHCONH ₂	-H	509
1587	$-CH_3$	-H	-Н	-CH ₂ CH ₂ COCH ₃	-H	-H	521
1588	$-CH_3$	-H	-Н	-Н	$-NHC_6H_5$	-H	542
1589	$-CH_3$	-H	-Н	$-NH_2$	-H	-C1	500
1590	$-CH_3$	-H	-H	-CH ₂ CO ₂ CH ₃	-H	-H	523
1591	-CH ₃	-H	-H	-OCH ₃	-Н	-C1	515
1592	-CH ₃	-H	-H	-H	-CO ₂ CH ₃	–H	509
1593	$-CH_3$	-H	-H	-COCH ₃	-H	-CONH ₂	536
1594	-CH ₃	-H	-Н	-COC ₂ H ₅	-H	-H	507
1595	-CH ₃	-H	-H	-COCH ₃	-H	-CH ₃	507
1596	$-CH_3$	-H	-H	-COCH ₃	-OH	−H	509
1597	$-CH_3$	-Н	-H	-NHCOCH ₃	-H	− H	508
1598	-CH ₃	-Н	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₃	- H	493
1599	-CH ₃	-H	-H	-H	-Н	$-CH_2C_6H_5$	541
1600	-CH ₃	-H	-OCH ₃	-H	-H	-CO ₂ CH ₃	539
1601	-CH ₃	-H	-Н	-SCH ₃	-H	-Н	497
1602	-CH ₃	-Н	-Н	-CHF ₂	-Н	-н	517

表 9 4

U			
実施例	R1	R2	MS (M+1)
1603	-CH ₃		495
1604	-СH ₃		501
1605	−СН ₃		507
1606	-СН ₃	$-\sqrt{N}$	518
1607	-СН ₃	0-N	518
1608	-CH ₃	$\begin{array}{c} \\ \\ \\ \\ \\ \\ \\ \\ \\ \\ \\ \\ \\ \\ \\ \\ \\ \\ \\$	522
1609	−CH³		519
1610	−СН ₃	-CH3	531
1611	-CH ₃	S 0	525
1612	−СН ₃	N	502

表 9 5

U			
実施例	R1	R2	MS(M+1)
1613	-CH ₃		502
1614	−CH ₃	$-\sqrt{N}$. 517
1615	-СH ₃	$\begin{array}{c} \begin{array}{c} \\ \\ \end{array} \begin{array}{c} \\ \end{array} \end{array} \begin{array}{c} \\ \end{array} \end{array} \begin{array}{c} \\ \end{array} \begin{array}{c} \\ \end{array} \begin{array}{c} \\ \end{array} \begin{array}{c} \\ \end{array} \end{array} \begin{array}{c} \\ \end{array} \end{array} \begin{array}{c} \\ \end{array} \end{array} \begin{array}{c} \\ \end{array} \end{array} \begin{array}{c} \\ \end{array} \end{array} \begin{array}{c} \\ \end{array} \end{array} \begin{array}{c} \\ \end{array} \end{array} \begin{array}{c} \\ \end{array} \end{array} \begin{array}{c} \\ \end{array} \end{array} \begin{array}{c} \\ \end{array}$	521
1616	−СН ₃		541
1617	−СН ₃		519
1618	-CH ₃		505
1619	-CH ₃		502
1620	-СН ₃	CH ₃	516
1621	−CH ₃		507
1622	−CH ₃		505

表96

実施例	j R1	R2	MS (M+1)	
1623	−СН ₃		491	
1624	-СН ₃	S	584	
1625	−CH³	H ₃ C	582	
1626	−СH ₃	- N	516	
1627	−CH ₃	\bigcirc N	568	
1628	-CH ₃	- N N $-$ CI	659	
1629	−СН ₃	$- \underbrace{\bigcirc N - N}_{N} \underbrace{\bigcirc CH_{3}^{CH_{3}}}_{CH_{3}}$	635	
1630	−СН ₃	$ CH_3$	673	
1631	−СН ₃	$-\langle s \rangle$	508	
1632	-CH ₃		505	

表97

実施例	R1	R2	MS (M+1)
1633	−CH ₃	N	452
1634	−СН ₃	Z	452 _.
1635	-СН ₃	N ₀	492
1636	−CH ₃	N.C	493
1637	-СН ₃	T _N	503
1638	-СН ₃		0

表98

$$R_{0_2N}$$
 N O R_1 O N N N N N

実施例	R1	R2	R3	R4	mp(°C)or ¹H NMR
1639	$-CH_3$	-H	-H	-CH ₂ C ₆ H ₅	208 - 210.5
1640	$-CH_3$	-H	-H	4-BrPhCH ₂ -	213. 5 - 215. 4
1641	$-CH_3$	-H	-Н	4-BrPhCH ₂ OCO-	185. 4 - 188. 5
1642	$-CH_3$	-H	-H	$-cyclo-C_6H_{11}$	255.4 - 257.9 dec
1643	$-CH_3$	-H	-H	4-CF ₃ PhCH=N-	178.0 - 278.6
1644	$-CH_3$	-H	-H	4-CF ₃ OPh0C0-	226. 5-226. 8
1645	$-CH_3$	-H	-H	4-CF ₃ PhCCCH ₂ OCO-	186. 4–187. 7
1646	-H	-H	-H	4-CF ₃ 0Ph-	232.0 - 234.5
1647	-H	-H	-H	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	171.4 - 172.9
1648	-H	-H	-H	4-C1PhCH ₂ -	191. 2-192. 0
					¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.48(9H, s),
					2.99-3.04(4H, m), 3.55-3.60(4H,
1649	− H	-H	-H	(CH ₃) ₃ COCO-	m), 4.22-4.37(2H, m), 4.39-
					4.49(2H, m), 5.56-5.63(1H, m),
***************************************			·		6.79-6.91(4H , m), 7.63(1H , s).

表99

$$R_{1}$$
 R_{2}
 R_{3}
 R_{4}

1102						
実施例	R1	R2	R3	R4	R5	MS(M+1)
1650	-H	-CF ₃	-Н	-H	-H	518
1651	-H	- H	$-NO_2$	-H	-H	495
1652	-H	-H	-CF ₃	-H	-H	518
1653	-H	-H	−CH ₃	-H	-H	464
1654	-H	-Н	-CN	H	-H	475
1655	-H	-H	$-C_6H_5$	-H	-Н	526
1656	-H	-H	- F	-H	-H	468
1657	-H	-C1	-C1	-H	−H	518
1658	$-CF_3$	-H	-H	-H	-H	518
1659	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	480
1660	-H	-H	-SCH ₃	-H	-H	496
1661	-H	-H	-SO ₂ CH ₃	−H	-H	528
1662	-H	-H	$-\text{OCH}_2\text{C}_6\text{H}_5$	–H	-H	556
1663	-H	-C1	-H	-C1	-H	518
1664	-F	-F	-F	-H	− H	504
1665	-H	-Н	−0COCH ₃	-Н	-Н	508

表100

$$0_2N \qquad N \qquad 0 \qquad 0 \qquad N \qquad 0 \qquad 0$$

実施例	R1	MS (M+1)	*********
1666	4-CF ₃ 0Ph-	564	
1667	4-CH ₃ 0PhCH ₂ -	524	
1668	4-CH ₃ PhCH ₂ -	508	
1669	4-CH ₃ O ₂ CPhCH ₂ -	552	
1670	$-CH_2C_6H_5$	494	
1671	4-CH ₃ SPhCH ₂ -	540	
1672	4-NO ₂ PhCH ₂ -	539	
1673	3, 4, 5-(CH ₃ 0) ₃ PhCH ₂ -	584	
1674	2-CH ₃ CONHPhCH ₂ -	551	
1675	4-FPhCH ₂ -	512	
1676	4-CF ₃ 0PhCH ₂ -	578	
1677	4-PhCH ₂ OPhCH ₂ -	600	
1678	4-CF ₃ SPhCH ₂ -	594	
1679	3-CF ₃ 0PhCH ₂ -	578	
1680	2 -CF $_3$ 0PhCH $_2$ -	578	
1681	$C_6F_5CH_2-$	584	
1682	PhCH=CHCH ₂ -	520	
1683	4 -C1PhCH=CHCH $_2$ -	554	
1684	4 -CF $_3$ 0PhCH=CHCH $_2$ -	604	
1685	$-(CH_2)_2C_6H_5$	508	
1686	Ph (CH_2) 3-	522	
1687	PhCCCH ₂ -	518	
1688	PhS (CH_2) $_2$ -	540	
1689	$PhCH_2O(CH_2)_2$	538	
1690	-CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	458	
1691	-CH ₂ CH ₂ CN	457	
1692	CH_3 $(CH_2)_{15}$	628	
1693	${ m CH_3CH_2O}$ ${ m (CH_2)}$ ${ m _2O}$ ${ m (CH_2)}$ ${ m _2-}$	520	
1694	-CH ₂ CH ₂ CCH	456	
1695	CF ₃ CF ₂ CF ₂ CH ₂ -	586	
1696	-CH ₂ -cyclo-C ₃ H ₅	458	

表101

II N			0-R1
	0	_NN-	~,

O ₂ N N	· ·	•	
実施例	R1	MS(M+1)	
1697		495	
1698		495	
1699		484	
1700	S	584	
1701	N N C I	596	
1702	S O F F F	634	·
1703	/—\(\)N	495	
1704		552	
1705		509	
1706		484	

表102

表103

実施例	R1	MS(M+1)	***************************************
1710	-CH ₂ CH=CH ₂	400	,
1711	$-C_6H_{13}$	444	
1712	-CH ₂ CN	399	
1713	$-$ (CH $_2$) $_2$ CH (CH $_3$) $_2$	430	
1714	-CH ₂ CON (CH ₃) ₂	445	

表104

実施例	R1	R2	mp(℃) or ¹H NMR
1715	-CH ₃	4-CF ₃ OPh-	157. 9 - 158. 8
1716	$-CH_3$	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	188.4 - 190.2
1717	$-CH_3$	4-CF ₃ OPhCH ₂ OCO-	112.1 - 115.4
1718	$-CH_3$	4-CF ₃ OPhCO-	
1719	−CH ₃	4-CF ₃ OPhNHCO-	

表105

$$0 \xrightarrow{N^{+}} N \xrightarrow{N} 0 \xrightarrow{R2} R3$$

			KI	
実施例	R1	R2	R3	mp(°C)
1720	-Н	4-CF ₃ OPh-	−CH ₃	126. 9-128. 9
1721	-H	4-CF ₃ OPh-	$-C_2H_5$	102. 1 - 103. 1
1722	-H	4-ClPh-	$-C_2H_5$	121.7 - 123.6
1723	-H	$-C_6H_5$	$-CH_3$	169.5 - 171.0
1724	-H	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	$-CH_3$	134. 8 - 136. 8
1725	-H	4-C1PhCH ₂ -	$-CH_3$	161.4 - 164.1
1726	-Н	4-CF ₃ PhCH ₂ -	$-CH_3$	136. 4 - 137. 9
1727	-H	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	$-C_2H_5$	119 - 120.5
1728	-H	4-CF ₃ PhCH ₂ -	$-C_2H_5$	134. 3 - 135. 7
1729	-H	4-C1PhCH ₂ -	$-C_2H_5$	135. 8 - 137
1730	$-\mathbf{F}$	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	-CH ₃	132.7 - 134.7
1731	-H	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	135. 9 — 137
1732	-H	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	$-C_6H_5$	198. 9 — 200. 8
1733	-H	4-CF ₃ PhCH ₂ -	$-C_6H_5$	192. 7 — 194. 7
1734	-H	4-C1PhCH ₂ -	$-C_6H_5$	195.1 - 196.1
1735	—H	$-C_6H_5$	-COCH ₃	167.7 - 168.7
1736	-H	4-ClPh-	-COCH ₃	220.0 - 223.5
1737	-H	4-CF ₃ Ph-	-COCH ₃	223.1 - 224.6
1738	-Н	4-CF ₃ OPh-	-COCH ₃	243.6 - 244.9
1739	-F	4-C1Ph-	-COCH ₃	221.8 - 223.0
1740	$-\mathbf{F}$	4-CF ₃ OPh-	-COCH ₃	240. 3 — 242. 9
1741	-H	$-C_6H_5$	$-CO_2CH_3$	182.7 - 184.8
1742	-H	4-C1Ph-	$-CO_2CH_3$	244.0 - 245.1
1743	-H	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	-H	151.4 - 154.3
1744	-H	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	$-CO_2C_2H_5$	105. 1 - 107. 6
1745	- H	4-C1Ph(CH ₂) ₂ -	$-CH_3$	116.1 - 117.6
1746	-H	$4-CF_3OPhO(CH_2)_3-$	-H	189.9 - 191.0
1747	-Н	4-CF ₃ 0PhCO-	−CH ₃	143.3 — 145.9

表106

$$0 \xrightarrow{N^{+}} 0 \xrightarrow{N^{-}} 0 \xrightarrow{R2} R3$$

			K	· I
実施例	R1	R2	R3	¹H NMR
1748	-H	4-CF ₃ Ph-	-CH_3	¹ H NMR(CDCl ₃) δ 1.80(3H,s),3.28(3H,s),4.06(1H, d,J=10.2Hz),4.11(1H,d,J=10.2Hz),4.26(1H, d, J=10.2Hz), 4.52(1H, d, J=10.2Hz), 6.70(2H, d, J=8.7Hz), 6.88(2H, d, J=8.8Hz), 7.13(2H, d, J=8.8Hz), 7.39(2H, d, J=8.7Hz), 7.57(1H, s).
1749	-H	4-ClPh-	$-\mathrm{CH_3}$	¹ H NMR(CDCl ₃) δ 1.79(3H, s), 3.22(3H, s), 4.04(1H, d, J=10.4Hz), 4.08(1H, d, J=10.4Hz), 4.23(1H, d, J=10.1Hz), 4.50(1H, d, J=10.1Hz), 6.70-6.73(2H, m), 6.81-6.84(2H, m), 7.03- 7.06(2H, m), 7.12-7.15(2H, m), 7.56(1H, s).
1750	-H	$4 ext{-} ext{CF}_3 ext{Ph-}$	$\text{-}\mathrm{C}_2\mathrm{H}_5$	¹ H NMR(CDCl ₃) & 1.20(3H, d, J=7.1Hz), 1.81(3H, s), 3.71(2H, q, J=7.1Hz), 4.07(1H, d, J=10.2Hz), 4.11(1H, d, J=10.2Hz), 4.27(1H, d, J=10.2Hz), 4.52(1H, d, J=10.2Hz), 6.63- 6.66(2H, m), 6.88-6.91(2H, m), 7.10-7.12(2H, m), 7.34-7.37(2H, m), 7.57(1H, s).
1751	-F	4-ClPh-	-CH_3	¹ H NMR(CDCl ₃) δ 1.80(3H, s), 3.20(3H, s), 4.06(1H, d, J=10.2Hz), 4.09(1H, d, J=10.1Hz), 4.25(1H, d, J=10.1Hz), 4.49(1H, d, J=10.2Hz), 6.54-6.57(2H, m), 6.64-6.71(2H, m), 7.09- 7.19(3H, m), 7.57(1H, s).
1752	-H	$4 ext{-} ext{CF}_3 ext{OPhCH}_2 ext{-}$	$-\mathrm{COCH_3}$	¹ H NMR(CDCl ₃) δ 1.79(3H, s), 1.85(3H, s), 4.06(1H, d, J=10.2Hz), 4.08(1H, d, J=10.2Hz), 4.24(1H, d, J=10.2Hz), 4.48(1H, d, J=10.2Hz), 4.82(2H, s), 6.78-6.82(2H, m), 6.88-6.91(2H, m), 7.09-7.11(2H, m), 7.20-7.22(2H, m), 7.56(1H, s).
1753	-H	4-CF ₃ OPhCO-	$-\mathrm{CH_3}$	¹ H NMR(CDCl ₃) δ 1.76(3H, s), 3.45(3H, s), 4.03(1H, d, J=10.1Hz), 4.04(1H, d, J=10.2Hz), 4.18(1H, d, J=10.1Hz), 4.46(1H, d, J=10.2Hz), 6.69-6.72(2H, m), 6.95-6.98(2H, m), 7.37- 7.46(4H, m), 7.55(1H, s).
1754	-H	4-ClPhCO-	-CH ₃	¹ H NMR(CDCl ₃) δ 1.77(3H, s), 3.43(3H, s), 4.03(1H, d, J=10.1Hz), 4.04(1H, d, J=10.2Hz), 4.18(1H, d, J=10.1Hz), 4.46(1H, d, J=10.2Hz), 6.69-6.72(2H, m), 6.94-6.97(2H, m), 7.13-7.23(4H, m), 7.55(1H, s).
1755	-H	4-ClPhCO-	-H	¹ H NMR(DMSO) δ 1.68(3H, s), 4.17-4.20(1H, m), 4.22-4.30(2H, m), 4.36-4.39(1H, m), 6.88-6.91(2H, m), 7.57-7.66(4H, m), 7.94-7.97(2H, m), 8.15(1H, s), 10.19(1H, brs).

表107

$$0 \xrightarrow{N^{+}} N \xrightarrow{N^{-}} 0 \xrightarrow{R2} R3$$

	**************************************		R1	
実施例	R1	R2	R3	¹H NMR
				¹ H NMR(DMSO) δ 1.68(3H,s), 4.17-
				4.20(1H, m), 4.22-4.30(2H, m), 4.36-
1756	-H	4-C1PhCO-	-H	4.39(1H, m), 6.88-6.91(2H, m), 7.57-
				7.66(4H, m), 7.94-7.97(2H, m),
				8.15(1H, s), 10.19(1H, brs).
				¹ H NMR(DMSO) δ 1.68(3H, s), 4.17-
				4.21(1H, m), 4.24-4.30(2H, m), 4.36-
1757	-H	4-CF ₃ PhCO-	-H	4. 40 (1H, m), 6. 90-6. 93 (2H, m), 7. 65-
		Ü		7. 68 (2H, m), 7. 88-7. 90 (2H, m), 8. 11-
				8.13(2H, m), 8.16(1H, s), 10.35(1H,
				brs).
				¹ H NMR (DMSO) δ 1.68 (3H, s), 4.17-
				4. 20 (1H, m), 4. 24–4. 31 (2H, m), 4. 36–
1758	-H	4-CF ₃ OPhCO-	-H	4. 40 (1H, m), 6. 89–6. 92 (2H, m), 7. 49–
				7. 52 (2H, m), 7. 63–7. 66 (2H, m), 8. 04–
				8.06(2H, m), 8.16(1H, s), 10.23(1H, brs).
1759	-H	4-C1Ph-	-Н	142.6 - 144.7
1760	H	4-CF ₃ OPh (CH ₂) ₂ -	-H	142.0 — 144.7
1761	-H	4-CF ₃ OPh (CH ₂) ₂ -	-CH ₃	
1762	-H	4-CF ₃ OPhO (CH ₂) ₃ -		107.6 - 109.2
1763	-H	4-CF ₃ OPhCOCH ₂ -		101.0 - 103.2
1764	-H	4-CF ₃ OPhCOCH ₂ -		

表108

実施例	R1	R2	R3	mp(℃) or ¹H NMR
1765				
1766	-CH ₃		4-C1Ph-	171. 5 - 173. 5
	-CH ₃		4-CF ₃ Ph-	172. 2 - 174. 9
1767	·	$-CH_3$	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	
1768	$-CH_3$	−H	4-CF ₃ OPh-	165.1 - 167.2
1769	$-CH_3$	$-COCH_3$	4-CF ₃ 0Ph-	128. 4 - 130. 8
1770	$-CH_3$	-CH ₃	4-CF ₃ 0Ph-	113. 6 - 114. 5
1771	$-CH_3$	$-CH_3$	4-CF ₃ Ph-	168. 2 - 170. 7
1772	$-CH_3$	-COCH ₃	4-CF ₃ Ph-	132.8 - 133.9
1773	-CH ₃	-CH ₃	4-C1Ph-	160.9 - 163.4
	Ü	ŭ		¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.21 (3H, t,
				d=7.1), 1.77(3H, s), 4.05(1H, d,
				J=10. 3Hz), 4. 06(1H, d, J=10. 2Hz),
1774	-CH.	-C0.C.H.	4-CF ₃ OPh-	4. 15-4. 22 (3H, m), 4. 49 (1H, d,
1	0113	00202115	1 01 301 11	J=10. 3Hz), 4. 78(2H, s), 6. 74-
				6. 78 (2H, m), 7. 07–7. 13 (6H, m),
				7. 55 (1H, s).
				¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.78 (3H, s),
				1.86(3H, s), 4.03(1H, d, J=10.2Hz),
				4.05(1H, d, J=10.1Hz), 4.21(1H, d,
1775	$-CH_3$	−COCH ₃	4-C1Ph-	J=10.1Hz), 4.48(1H, d, J=10.2Hz),
				4.78(2H, s), 6.71-6.74(2H, m),
				6.87-6.89(2H, m), 7.08-7.11(2H, m),
				7.28-7.32(2H, m), 7.55(1H, s).

表109

実施例	R1	R2	mp(°C)
1776	-CH ₃	-4-PYRIDYL	228.2 - 229.8 dec
1777	$-CH_3$	-СНО	176. 0-179. 5
1778	$-CH_3$	4C1PhC0-	186. 2 - 188. 5
1779	$-CH_3$	4-CF ₃ PhCO-	170.3 - 172.4
1780	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCO-	159.7 - 160.7

表110

実施例	R1	R2	mp(°C) or ¹H NMR
1781	-CH ₃	_N0	177.4-184.3
1782	-CH ₃	_NO	196.3 – 197.8
1783	-CH ₃	-N 0 0	212.3-214.0
1784	$-\mathrm{CH_3}$	-N CI	251.9 – 253.0
1785	-CH ₃	-NCI	216.7 – 219.5 dec
1786	$-\mathrm{CH_3}$	$-N$ \longrightarrow -0 F F	248.1 - 248.2
1787	$-\mathrm{CH_3}$	$\bigcap_{0} \bigcap_{F} F$	150.3 – 154.9
1788	$-\mathrm{CH_3}$	NO FF	150.8 - 151.2
1789	-CH₃	-N $0H$ 0 F F F	¹ H NMR(CDCl ₃) δ 1.55(1H, s),1.60 (1H, s), 1.77(3H, s), 1.80-1.95(2H, m), 2.15-2.40(2H, m), 3.04-3.27(2H, m),3. 33-3.53(2H, m), 3.95-4.11(2H, m),4.19 (1H, d, J=10.2Hz), 4.50(1H, d,J=10.2 Hz), 6.71-6.86(2H, m), 6.88-7.02(2H, m), 7.14-7.31(2H, m), 7.47-7.63(3H, m).
1790	-CH ₃	-N	¹ H NMR(DMSO) & 1.67(3H, s), 2.61 (2H, brs), 3.74(2H, d, J=2.9Hz), .17(1H, d, J=13.0Hz), 4.21(2H, s), 6.28(1H, s), 6.81(2H, d, J=9.1Hz), 6.94(2H, d,J=9.2Hz), 7.18-7.57(5H, m), 8.17(1H, s).

表111

実施例	J R1	R2	mp(℃) or ¹H NMR
1791	-CH ₃	√N CI	202. 0 - 203. 5
1792	-CH ₃		206. 0
1793	-СH ₃	O F F	247.8 - 249.8
1794	−СН ₃	ÇH ₃ 0 F	97.7 — 99.7
1795	−СН ₃	N N H F F	172. 5–175. 8
1796	-СН ₃	H	160.7 - 163.0
1797	−СН ₃	H ₃ C F F	1 H NMR (CDCl ₃) δ 1.81 (3H, s), 3.44 (3H, s), 4.06 (1H, d, J=10.24Hz), 4.12 (1H, d, J=10.0Hz), 4.27 (1H, d, J=10.0Hz), 4.52 (1H, d, J=10.2Hz), 6.83-6.91 (2H, m), 7.39-7.45 (2H, m), 7.51-7.56 (3H, m), 7.57 (1H, s), 7.62-7.68 (2H, m)

表112

実施例	R1	R2	mp(℃) or ¹H NMR
1798	−СН ₃	N N F	1 H NMR (CDCl ₃) δ 1.80(3H, s), 4.01–4.14(2H, m), 4.26(1H, d, J=10.0Hz), 4.51(1H, d, J=10.3Hz), 6.85(2H, d, J=8.6Hz), 7.03–7.09(4H, m), 7.53–7.60(4H, m), 7.66(1H, s)
1799	−CH ₃	N N CI	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.81 (3H, s), 4.05 (1H, d, J=10.3Hz), 4.11 (1H, d, J=10.0Hz), 4.26 (1H, d, J=10.0Hz), 4.51 (1H, d, J=10.3Hz), 6.83-7.05 (4H, m), 7.20-7.26 (2H, m), 7.51-7.60 (4H, m), 7.65 (1H, s)
1800	-СН ₃	N F F	
1801	-CH ₃	$\bigcap_{\text{CH}_3} 0 \xrightarrow{\text{F}} F$	
1802	−CH ₃	F F	
1803	-CH ₃	ÇH ₃ N F F	209. 1 - 212. 9

表113

						•• ••
実施例	R1	R2	R3	R4	R5	MS (M+1)
1804	− H	-CF ₃	-H	-Н	-Н	517
1805	-H	-H	$-NO_2$	-H	-H	494
1806	-H	-H	-CF ₃	-H	-H	517
1807	-H	-H	$-CH_3$	-H	-H	463
1808	-H	-H	-CN	-H	-Н	474
1809	-H	-H	$-C_6H_5$	−H	-H	525
1810	-H	-H	- F	-H	-H	467
1811	-H	-C1	-C1	-H	-H	517
1812	$-CF_3$	-H	-H	-H	-H	517
1813	-H	-H	$-0CH_3$	-H	-H	479
1814	-H	-H	-SCH ₃	-H	− H	495
1815	−H	-H	$-SO_2CH_3$	-H	-H	527
1816	-H	H.	$-0\mathrm{CH_2C_6H_5}$	-H	-H	555
1817	-H	-C1	-H	-C1	-Н	517
1818	-F	-F	-F	-H	−H	503
1818	-Н	-H	-OCOCH ₃	-H	-H	507

表114

実施例	R1	MS(M+1)	
1820	4-CF ₃ 0Ph	563	
1821	4-CH ₃ OPhCH ₂ -	523	
1822	4−CH ₃ PhCH ₂ −	507	
1823	4-CH ₃ O ₂ CPhCH ₂ -	551	
1824	$-CH_2C_6H_5$	493	
1825	4-CH ₃ SPhCH ₂ -	539	
1826	4-NO ₂ PhCH ₂ -	538	
1827	3, 4, 5-(CH ₃ 0) ₃ PhCH ₂ -	583	
1828	2-CH ₃ CONHPhCH ₂ -	550	
1829	4-FPhCH ₂ -	511	
1830	4 –CF $_3$ OPhCH $_2$ –	577	
1831	4-PhCH ₂ OPhCH ₂ -	599	
1832	4-CF ₃ SPhCH ₂ -	593	
1833	3-CF ₃ 0PhCH ₂ -	577	
1834	2-CF ₃ 0PhCH ₂ -	577	
1835	C ₆ F ₅ CH ₂ -	583	
1836	PhCH=CHCH ₂ -	519	
1837 .	4 -C1PhCH=CHCH $_2$ -	553	
1838	4-CF ₃ OPhCH=CHCH ₂ -	603	
1839	$-(CH_2)_2C_6H_5$	507	
1840	Ph (CH_2) $_3$ -	521	
1841	PhCCCH ₂ -	517	
1842	PhS (CH_2) $_2$ -	539	
1843	$PhCH_2O$ (CH_2) $_2$ -	537	
1844	-CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	457	
1845	-CH ₂ CH ₂ CN	456	
1846	${ m CH_3CH_2O}$ ${ m (CH_2)}$ ${ m _2O}$ ${ m (CH_2)}$ ${ m _2-}$	519	
1847	-CH ₂ CH ₂ CCH	455	
1848	CF ₃ CF ₂ CF ₂ CH ₂ -	585	
1849	-CH ₂ -cyclo-C ₃ H ₅	457	

表115

NO ₂	N 0 0)—(0—R1
実施例	R1	MS(M+1)
1850	\N	494
1851	N_	494
1852		483
1853	S	583
1854	N N CI	595
1855	~\s\	499
1856	\N	494
1857		551
1858	N	508
1859		483
1860		519
1861	0, 0, 0-	528

表116

実施例	R1	MS (M+1)	
1862		543	

表117

実施例
1863
1864

		·	
実施例	R1	MS(M+1)	
1863	-CH ₂ CH=CH ₂	399	
1864	$-(CH_2)_2C_6H_5$	463	
1865	$-C^{6}H^{13}$	443	
1866	-CH ₂ CN	398	
1867	$-CH_2CON(CH_3)_2$	444	
1868	PhCOCH ₂ -	477	

表118

$$R_1$$
 N_2
 N_3
 N_4
実施例	R1	R2	mp(°C)
1869	-CH ₃	4-CF ₃ PhCH ₂ -	171.4 - 172.4
1870	$-CH_3$	4-CF ₃ PhCH ₂ OCO-	130.4 - 131.7
1871	$-CH_3$	4-C1PhCH ₂ OCO-	126.8 - 129.1
1872	$-CH_3$	4-CF ₃ OPhCH ₂ OCO-	143.8 - 144.8
1873	$-CH_3$	4-C1PhCH ₂ -	183.0 - 187.2
1874	$-CH_3$	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	174.3 - 176.5
1875	$-CH_3$	4-CF ₃ Ph-	156.7 - 157.7
1876	$-CH_3$	$(CH_3)_3COCO-$	197.0 - 198.2
1877	−CH ₃	4-CF ₃ 0Ph-	154.5 - 156.7

表119

mp(°C) or ¹H NMR 実施例 **R2** R1-CH₃ 4-ClPhCH₂-214.3 - 216.1 1878 1879 -CH₃ 4-CF₃Ph-158.5 - 160.1 -CH₃ 4-CF₃0Ph-161.7 - 164.41880 -CH₃ 4-C1Ph-163.5 - 166.3 1881 ¹H NMR (CDCl₃) δ 1.76(3H, s), 4.02(1H, d, J=10.2Hz), 4.04(1H, d, J=10.2Hz), 4.18(1H, d, J=10.2Hz), 4.48(1H, d, J=10.2Hz), 1882 -CH₃ 4-CF₃OPhCH₂-5.00(2H, s), 6.77-6.81(2H, m), 6.85-6.90(2H, m), 7.21-7.23(2H, m), 7.42-7.45(2H, m), 7.54(1H, s). ¹H NMR (CDCl₃) δ 1. ⁷77(3H, s), 4. 02(1H, d, J=10.2Hz), 4.04(1H, d, J=10.2Hz), 4.18(1H, -CH₃ 4-CF₃PhCH₂d, J=10.2Hz), 4.49(1H, d, J=10.2Hz), 1883 5.07(2H, s), 6.77-6.81(2H, m), 6.85-6.91(2H, m), 7.51-7.55(3H, m), 7.62-7.65(2H, m).

実施例1884

- $(R) 2 \lambda f \nu 6 2 \{4 \{4 \{4 \{4 \} \} \} 2 \}$ オシフェノキシ) ピペリジン $1 4 \nu$] フェノキシメチル $\} 2$, $3 3 3 \nu$ に ロイミダゾ [2, 1 b] オキサゾールの製造
- 4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)ピペリジン-1-イル] フェノール(693mg、1.96mmol)をN, N'ージメチルホルムアミド(3ml)に溶解し、氷冷下にて水素化ナトリウム(86mg、2.16mmol)を加え、70-75℃にて20分攪拌した。この混合物を氷冷し、(R)-2-ブロモ-4-ニトロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチ
- 10 ル)イミダゾール(720mg、2.75mmol)をN, N'ージメチルホルムアミド(3ml)に溶解した溶液を加え、70-75℃にて20分攪拌した。反応液を室温に戻し、氷水(25ml)を加え、塩化メチレン(50ml)により3回抽出した。有機層を合わせ、3回水洗後、硫酸マグネシウムにより乾燥した。減圧濾過後、濾液を濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー
- 15 (塩化メチレン/酢酸エチル= 3 / 1)により精製した。酢酸エチル/イソプロピルエーテルから再結晶することにより微黄色粉末の(R)-2 / 2 / 4 -
- 20 実施例1885
 - (1) (S) -4-[3-(2-プロモ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル] ピペラジン-1-カルボン酸3-(4-トリフルオロメチルフェニル) <math>-2-プロペニルエステルの製造
- (R) -2-ブロモー4-ニトロー1-(2-メチルー2-オキシラニルメチ25 ル) イミダゾール(2.04g、7.78mmol)、ピペラジン-1-カルボン酸3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルエステル(2.69g、8.56mmol)、N,N'-ジメチルホルムアミド(10ml)の混合物を50℃にて20時間攪拌した。反応液を室温に戻し、水(45ml)を加え、酢酸エチル(15ml)により2回抽出した。有機相を合わせ、3回水洗

し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。減圧濾過後、濾液を濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=1/2)により精製することにより、黄色油状物質の(S)-4-[3-(2-ブロモ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル] ピペラジン-1-カルボン酸3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルエステル(3.77g、84%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δppm

- 1. 16 (3H, s), 2. 36 (1H, d, J=14. 0Hz), 2. 43-2. 76 (5H, m), 3. 21 (1H, s), 3. 41-3. 57 (4H,
- 10 m), 4. 01 (2H, s), 4. 78 (2H, dd, J=1. 0Hz, 6. 1 Hz), 6. 29-6. 43 (1H, m), 6. 66 (1H, d, J=16. 0 Hz), 7. 48 (2H, d, J=8. 3Hz), 7. 58 (2H, d, J=8. 3Hz), 8. 10 (1H, s).
 - (2) (S) -4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ
- 15 [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸3-(4-トリフルオロメチルフェニル) -2-プロペニルエステルの製造
 - (S) -4-[3-(2-プロモー4ーニトロイミダゾールー1ーイル)-2ーヒドロキシー2-メチルプロピル]ピペラジンー1-カルボン酸3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルエステル(3.5g、6.07
- 20 mmol)をN, N'ージメチルホルムアミド(10.5ml)に溶解し、氷冷下にて水素化ナトリウム(316mg、7.89mmol)を加え、同温度下にて1.5時間攪拌した。反応液に酢酸エチル(3.5ml)、水(24.5ml)を加え、30分攪拌した。析出晶を濾取し、水洗した。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル)により精製した。2ープロパノール/
- 25 水から再結晶することにより微黄色粉末の(S) -4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダブ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸3-(4-トリフルオロメチルフェニル) -2-プロペニルエステル(2.07g、69%)を得た。

試験例1

抗菌試験(寒天平板希釈法)

実施例397で得られた2、3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物について、結核菌属(M. tuberculosis H37Rv)に対する最小発育阻止濃度を、7H11培地(BBL社製)を用いて求めた。上記菌株は、予め7H9培地(BBL社製)で培養し、生菌数を算出し、-80で凍結保存した菌液を使用し、最終生菌数を約 10^6 CFU/mlに調製しておいた。このように調製した菌液を、試験化合物含有の7H11寒天培地に $5\mu1$ 接種し、37℃で14日間培養した後、最小発育阻止濃度を測定するための試験に供した。

M. tuberculosis H37Rvに対する最小発育阻止濃度は、0.024μg/mlであった。

請 求 の 範 囲

1. 一般式 (1)

$$O_2N \longrightarrow N \longrightarrow R^1$$

$$(CH_2)nR^2 \qquad (1)$$

で表される2,3-ジヒドロー6-ニトロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール 化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩:

[式中、 R^1 は水素原子又は $C1\sim6$ アルキル基を示す。nは $0\sim6$ の整数を示 10 す。 R^2 は下記一般式(A)、(B)、(C)、(D)、(E)、(E)、(F)又は (G)で表される基を示す。また、 R^1 及びー(CH_2) $_n$ R^2 は、隣接する炭素原子と共に窒素原子を介して互いに結合して下記一般式(H)で表されるスピロ環を形成していてもよい。

一般式(A)で表される基:

$$15 \qquad -OR^3 \qquad (A)$$

(式中、R³は、

- A1) 水素原子;
- A2) C1~6アルキル基:
- A3) C1~6アルコキシ-C1~6アルキル基;
- 20 A4) フェニル $C1\sim6$ アルキル基(フェニル環上には、フェニル $C1\sim6$ アルコキシ基;ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基;ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基及びフェノキシ基[フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基が少なくとも1個置換していてもよい]からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
- 25 A5) ビフェニリルC1~6アルキル基:
 - A6) フェニルC2~6アルケニル基:
 - A7) C1~6アルキルスルホニル基:
 - A8) $C1 \sim 6$ アルキル基が置換していてもよいベンゼンスルホニル基:
 - A9) C1~6アルカノイル基;

A10) 一般式 (Aa)で表される基:



(ここで R 4 は、C 1 ~ 6 アルコキシカルボニル基;フェニルC 1 ~ 6 アルコキ シカルボニル基 [フェニル環上には、フェニルC 1 ~ 6 アルコキシ基、ハロゲン 置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい]又はフェニルC 1 ~ 6 アルキル基 [フェニル環上には、フェニルC 1 ~ 6 アルコキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲ ン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲ くとも 1 種が置換していてもよい]を示す。):

- A11) ビフェニリルC1~6アルコキシカルボニル基;
- A12) ベンゾオキサゾリルC1~6アルキル基(ベンゾオキサゾール環上には、 少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい);
- 15 A13) ベンゾオキサゾリル基;

又は

A14) オキサゾリル $C1\sim6$ アルキル基(オキサゾール環上には、フェニル基及 び $C1\sim6$ アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換してい てもよい)を示す。

20 一般式 (B) で表される基:

$$-SR5$$
 (B)

(式中、 R^5 は、テトラゾリル基 [テトラゾール環上には、 $C1\sim6$ アルキル基 又はハロゲン原子を有することのあるフェニル基が置換していてもよい] 又はベンゾオキサゾリル基を示す)、

25 一般式 (C) で表される基:

$$-COOR^6$$
 (C)

(式中、 R^6 は $C1\sim6$ アルキル基を示す。)

一般式(D)で表されるカルバモイルオキシ基:

$$-OOCNR^7R^8$$
 (D)

(式中、 R^7 及び R^8 は、同一又は異なって、

- D1) 水素原子;
- D2) C1~8アルキル基:
- D3) ハロゲン置換C1~6アルキル基:
- 5 D4) C1~6アルコキシカルボニルーC1~6アルキル基:
 - D5) C3~8シクロアルキル基:
 - D6) フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン 置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していて
- 10 もよい);
 - D7) フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基、C1~6アルカノイル基、カルボキシル基、C1~6アルコキシカルボニル基、フェニルC1~6アルコキシカルボニル基、カルバモイル基、C1~6アルキルカルバモイル基、アミノスルホニル基及びモルホリノ基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい);
 - D8) ナフチル基;

又は

15

- D9) ピリジル基
- 20 を示す。
 - D10) R^7 及び R^8 は、これらが隣接する窒素原子と共に、他のヘテロ原子もしくは炭素原子を介し又は介することなく互いに結合して下記 $(D10-1)\sim (D10-3)$ に示す飽和複素環基又は下記 $(D10-4)\sim (D10-7)$ に示すベンゼン縮合複素環基を形成していてもよい。
- 25 (D10-1) 一般式 (Da) で示されるピペラジニル基:

$$-N$$
 $N-R^9$ (Da)

(ここでR ⁹は、

(Dal) 水素原子;

(Da2) C1~6アルキル基;

(Da3) フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

(Da4) フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1 種が置換していてもよい);

(Da5) C1~6アルコキシカルボニル基;

10 (Da6) フェニルC1~6アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

(Da7) フェニルC3~6アルケニルオキシカルボニル基(フェニル環上には、ハ 15 ロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基が少なくとも1個置換していて もよい);

又は

(Da8) フェニルC1~6アルキリデン置換アミノ基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよ

20 い)

を示す。);

(D10-2) 一般式 (Db) で示される基:

$$-N$$
 \rightarrow R^{10} (Db)

25 (式中、点線は二重結合であってもよいことを示す。R¹⁰は、

(Db1) 水素原子;

(Db2) フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1 種が置換していてもよい);

(Db3) フェノキシ基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい):

又は

(Db4) フェニルアミノ基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい)

を示す。);

(D10-3) モルホリノ基;

(D10-4) インドリニル基 (インドリン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい);

10 (D10-5) イソインドリニル基 (イソインドリン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい);

(D10-6) 1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル基(1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい);

15 又は

(D10-7) 1, 2, 3, 4ーテトラヒドロイソキノリニル基(1, 2, 3, 4ーテトラヒドロイソキノリン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい)

を示す。)

20 一般式(E)で表されるフェノキシ基:

$$-O \xrightarrow{(X)m}_{\mathbb{R}^{11}}$$
 (E)

[式中、Xはハロゲン原子又は置換基としてC1~6アルキル基を有することのあるアミノ置換C1~6アルキル基を示す。mは0~3の整数を示す。R 11 は、

25 E1) 水素原子:

- E2) ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基:
- E3) ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基:
- E4) 一般式 (Ea) で表される基:

$$- (W) o - NR^{12}R^{13}$$
 (Ea)

(式中、Wは基-CO-又はC $1\sim6$ アルキレン基を示す。 oは0又は1を示す。 R 12 及びR 13 は同-又は異なって、

- (Eal) 水素原子;
- (Ea2) C1~6アルキル基;
- 5 (Ea3) C1~6アルカノイル基;

が置換していてもよい。);

- (Ea4) C1~6アルコキシカルボニル基;
- ン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基; ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基及びフェノキシ基 [フェニル環上には、置換基としてハロゲ 10 ン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1 種が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。また、 $C1\sim6$ アルキル部分には、 $C1\sim6$ アルコキシイミノ基

(Ea5) フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子;ハロゲ

- 15 (Ea6) フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい); (Ea7) ベンゾイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
 - (Ea8) ピリジル基 (ピリジン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい) ;
 - (Ea9) フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン 世換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC
- 25 $1 \sim 6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい):
 - (Ea10) フェノキシC $1\sim6$ アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C $1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC $1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換して

いてもよい);

又は

(Ea11) ベンゾイルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換 のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)

を示す。);

- E5) イミダゾリル基;
- E6) トリアゾリル基;
- 10 E7) モルホリノ基:
 - E8) チオモルホリノ基:
 - E9) s オキシドチオモルホリノ基;
 - E10) 一般式(Eaa) で示されるピペリジル基:

15
$$-(W)o-N$$
 R^{14} (E a a)

(式中、W及び \circ は前記に同じ。 R^{14A} は、水素原子、水酸基、 $C1\sim6$ アルコキシ基又はフェニル基[フェニル環上には、ハロゲン原子が置換していてもよい。]を示す。点線は二重結合であってもよいことを示す。点線が二重結合を示なきます。点線が二重結合を示す。すときは、 R^{14} のみが置換しているものとする。 R^{14} 及び R^{14A} は、これらが隣接する炭素原子と共に互いに結合して $C1\sim4$ アルキレンジオキシ基を形成してもよい。 R^{14} は、

(Eaal) 水素原子;

(Eaa2) C1~6アルコキシカルボニル基:

25 (Eaa3) フェノキシ基(フェニル環上には、ハロゲン原子;ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基;ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基; C1~4アルキレンジオキシ基; C1~6アルコキシカルボニル基;シアノ基; C2~6アルケニル基;ニトロ基;フェニル基;置換基としてフェニル基、C1~6アルキル基、カルバモイル基及びC1~6アルカノイル基からなる

群より選ばれた基を有することのあるアミノ基;C1~6アルカノイル置換C1 ~6アルキル基;水酸基;C1~6アルコキシカルボニル置換C1~6アルキル 基;フェニルC1~6アルキル基;C1~6アルカノイル基;C1~6アルキル チオ基; 1, 2, 4-トリアゾリル基; イソオキサゾリル基: イミダゾリル基: ベンゾチアゾリル基:2H-ベンゾトリアゾリル基;ピロリル基;ベンゾオキサ ゾリル基;ピペラジニル基 [ピペラジン環上には、置換基としてC1~6アルコ キシカルボニル基及びフェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲ ン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未 置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換 していてもよい)からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していても 10 よい]:ピペリジル基[ピペリジン環上には、少なくとも1個のアミノ基が置換 していてもよい。該アミノ基上には置換基としてC1~6アルキル基及びフェニ ル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6ア ルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選 ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)からなる群より選ばれた基の 15 少なくとも1種が置換していてもよい。]及びカルバモイル基からなる群より選 ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

(Eaa4) 水酸基;

(Eaa5) カルボキシ基;

20 (Eaa6) フェニル基 (フェニル環上には、置換基としてフェノキシ基 [フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコ

25 キシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

(Eaa7) C1~6アルコキシ基;

(Eaa8) C3~8シクロアルキルーC1~6アルコキシ基:

(Eaa9) フェニルカルバモイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン 置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6ア ルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

- (Eaa10) テトラヒドロピラニルオキシ基;
- (Eaall) 1, 3-ジオキソラニル基:
- 5 (Eaa12) オキソ基:
 - (Eaal3) ナフチルオキシ基 (ナフタレン環上には、少なくとも1個のC1~6アルキル基が置換していてもよい) ;
 - (Eaal4) 2, 3-ジヒドロベンゾフリルオキシ基(2, 3-ジヒドロベンゾフラン環上には、 $C1\sim6$ アルキル基及びオキソ基からなる群より選ばれた基の少な
- 10 くとも1種が置換していてもよい);
 - (Eaal5) ベンゾチアゾリルオキシ基(ベンゾチアゾール環上には、少なくとも1個の $C1\sim6$ アルキル基が置換していてもよい);
 - (Eaa16) 1, 2, 3, 4ーテトラヒドロナフチルオキシ基(1, 2, 3, 4ーテトラヒドロナフタレン環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよ
- 15 V);
 - (Eaal7) 1, 3 ベンゾオキサチオラニルオキシ基(1, 3 ベンゾオキサチオラン環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい):
 - (Eaa18) イソキノリルオキシ基:
 - (Eaa19) ピリジルオキシ基:
- 20 (Eaa20) キノリルオキシ基 (キノリン環上には、少なくとも1個のC1~6アルキル基が置換していてもよい) :
 - (Eaa21) ジベンゾフリルオキシ基;
 - (Eaa22) 2 H クロメニルオキシ基 (2 H クロメン環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい) :
- 25 (Eaa23) ベンゾイソオキサゾリルオキシ基:
 - (Eaa24) キノキサリルオキシ基;
 - (Eaa25) 2, 3-ジヒドロー1 H-インデニルオキシ基(2, 3-ジヒドロー1 H-インデン環上には、少なくとも1 個のオキソ基が置換していてもよい); (Eaa26) ベンゾフラザニルオキシ基:

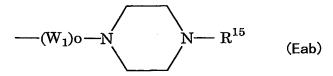
又は

(Eaa27) フェニルC 2~6 アルケニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1~6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1~6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していても

5 よい)

を示す。];

E11) 一般式 (Eab) で表される基:



10

15

20

[式中、oは前記に同じ。 W_1 は、低級アルキレン基を示す。 $R^{1.5}$ は、

(Eab1) 水素原子;

(Eab2) C1~6アルキル基(アルキル基上には、モルホリノ基、ベンゾイル基、 置換基としてC1~6アルキル基を有することのあるカルバモイル基又はシアノ 基が置換していてもよい);

(Eab3) C3~8シクロアルキル基:

(Eab4) フェニル $C1\sim6$ アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、フェニル基、ニトロ基、 $C1\sim6$ アルキルチオ基、 $C1\sim6$ アルキルスルホニル基、フェニル $C1\sim6$ アルコキシ基、 $C2\sim6$ アルカノイルオキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基及び1、2、3ーチアジアゾール基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

(Eab5) C2~6アルケニル基;

(Eab6) フェニル基 (フェニル環上にハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換も 25 しくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

(Eab7)C1~6アルカノイル基;

(Eab8) フェニルC2~6アルカノイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、

ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1 種が置換していてもよい);

(Eab9) ベンゾイル基 (ベンゼン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしく は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい); (Eab10) C1~20アルコキシカルボニル基 (アルコキシ基上には、ハロゲン原子、置換基としてC1~6アルキル基を有することのあるアミノ基及びC1~6アルコキシ置換C1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1 10 種が置換していてもよい):

(Eab11) フェニルC1~6アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲ

ン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基、ニトロ基、ハロゲン置換もしくは未置換の

C1~6アルキルチオ基、C1~6アルカノイル基を有することのあるアミノ基、

15 フェニルC1~6アルコキシ基、C1~6アルコキシカルボニル基及び1, 2, 3ーチアジアゾリル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

(Eab12) フェニルC 3~6 アルケニルオキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1~6 アルキル基及びハロゲン置

20 換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい);

(Eab13) フェノキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン 置換もしくは未置換 $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1 種が置換していてもよい):

(Eab14) フェニル $C1\sim6$ アルキルカルバモイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

(Eab15) フェニルカルバモイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン 置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1 ~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していても よい);

- 「5 (Eab16) ベンゾフリル置換C1~6アルコキシカルボニル基 (ベンゾフラン環上 には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい。); (Fab17) ベンゾチエニルC1~6アルコキシカルボニル基 (ベンゾチオフェン環
 - (Eab17) ベンゾチエニルC1~6アルコキシカルボニル基 (ベンゾチオフェン環上には、ハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
- 10 (Eab18) ナフチル置換 $C1\sim6$ アルコキシカルボニル基;
 - (Eab19) ピリジル置換C1~6アルコキシカルボニル基(ピリジン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい);
 - (Eab20) フリル置換C1~6アルコキシカルボニル基 (フラン環上には、少なくとも1個のニトロ基が置換していてもよい);
- 15 (Eab21) チエニル置換 $C1 \sim 6$ アルコキシカルボニル基(チオフェン環上には、 少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい);
 - (Eab22) チアゾリル置換 $C1\sim6$ アルコキシカルボニル基(チアゾール環上には、 $C1\sim6$ アルキル基及びフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい] からなる群
- 20 より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい); (Eab23) テトラゾリル置換C1~6アルコキシカルボニル基(テトラゾール環上には、C1~6アルキル基及びフェニル基[フェニル環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい]からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
- 25 (Eab24) 2, 3 ジヒドロー 1 H インデニルオキシカルボニル基;
 - (Eab25) アダマンタン置換C1~6アルコキシカルボニル基;
 - (Eab26) フェニルC3~6アルキニルオキシカルボニル基:
 - (Eab27) フェニルチオC1~6アルコキシカルボニル基;
 - (Eab28) フェニル $C1\sim6$ アルコキシ置換 $C1\sim6$ アルコキシカルボニル基;

1006

(Eab29) C2~6アルケニルオキシカルボニル基;

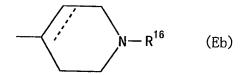
(Eab30) C2~6アルキニルオキシカルボニル基:

(Eab31) C3~8シクロアルキル置換C1~6アルコキシカルボニル基;

又は

5 (Eab32) ベンゾイル置換C1~6アルコキシカルボニル基を示す。);

E12) 一般式 (Eb) で表される基:



10

(式中、点線は二重結合であってもよいことを示す。 R^{16} は、 R^{15} と同一の基を示す。)

E13) 一般式 (E c) で示される基:

(式中、R¹⁷は、

(Ec1) フェニル $C1\sim6$ アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい):

(Ec2) C1~6アルコキシカルボニル基:

又は

20

(Ec3) フェニル $C1\sim6$ アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン 原子、ハロゲン置換もしくは未置換 $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1 種が 置換していてもよい)

を示す。):

E14) ピリジル基:

E15) 一般式 (Ee) で示される基:

$$-0$$
 $N-R^{46}$ (Ee)

(式中、R ⁴⁶は、フェニル基 [フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置 換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい];フェニルC 1~6アルキル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい];フェニルC 1~6アルコキシカルボニル基 [フェニル環上 には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい]又はC 1~6アルコキシカルボニル基を示す。);

E16) フェノキシ基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは 未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキ シ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい); E17) ベンゾイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは 未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキ シ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

20 E18) 8-アザビシクロ [3, 2, 1] オクチル基(8-アザビシクロ [3, 2, 1] オクタン環上には、少なくとも1 個のフェノキシ基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)が置換していてもよい);

25 E19) 一般式 (Ef) で示される基:

$$-CH = N - NR^{47}R^{48}$$
 (E f)

(式中、 R^{47} 及び R^{48} は、同一又は異なって、水素原子; $C1\sim6$ アルキル基;7ェニル基 [7ェニル環上には、7ロゲン原子、7ロゲン置換もしくは未置換 $C1\sim6$ アルキル基及び7ロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基

からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕又はピリジル基 [ピリジン環上には、置換基としてハロゲン置換もしくは未置換 $C1\sim67$ ルキル基を少なくとも1個が置換していてもよい〕を示す。また、この R^{47} 及び R^{48} は、これらが隣接する窒素原子と共に、他のヘテロ原子を介し又は介することなく互いに結合して $5\sim7$ 員環の飽和複素環を形成してもよい。該複素環上には、置換基として少なくとも1個のフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 $C1\sim67$ ルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換 $C1\sim67$ ルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換 $C1\sim67$ ルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換 $C1\sim67$ ルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換 $C1\sim67$ ルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕が置換していてもよい。);

- 10 E20) フェニルC1~6アルコキシ基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
- E21) アミノ置換C2~6アルケニル基(該アミノ基上には、C1~6アルキル 15 基及びフェニル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ 基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]からなる 群より選ばれる基の少なくとも1種が置換していてもよい); 又は
- 20 E22) オキサゾリジニル基 (オキサゾリジン環上には、少なくとも1個のオキソ 基が置換していてもよい)を示す。]
 - 一般式 (F) で表される基:

$$-NR^{19}R^{20}$$
 (F)

- 25 [式中、 R^{19} 及び R^{20} は、同一又は異なって、
 - F1) 水素原子;
 - F2) C1~6アルキル基:
 - F3) フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、フェノキシ基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及び

ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基 の少なくとも1種が置換していてもよい];ハロゲン原子;ハロゲン置換もしく は未置換のC1~6アルキル基;ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコ キシ基:アミノ基(アミノ基上には、C1~6アルキル基及びフェニルC1~6 アルキル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基から なる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]からなる群より 選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。);ピペラジニル基[ピペ ラジン環上には、少なくとも1個のフェニルC1~6アルキル基(フェニル環上 には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロ 10 ゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少 なくとも1種が置換していてもよい)が置換していてもよい〕及びピペリジル基 「ピペリジン環上には、少なくとも1個のアミノ基が置換していてもよい。該ア ミノ基上には、フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換も しくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6ア 15 ルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) 及びC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換して いてもよい。〕なる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよ *١*٧) ;

- 20 F4) フェノキシC $1 \sim 6$ アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン ン置換もしくは未置換のC $1 \sim 6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C $1 \sim 6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換してい てもよい);
- F5) アミノC1~6アルキル基(アミノ基上には、C1~6アルキル基、C1~25 6アルコキシカルボニル基及びフェニル基[フェニル環上には、ハロゲン原子もしくはハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
 - F6) フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、フェノキシ基 [フェニル環

上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕及びC1~6アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい):

- 5 F7) C1~6アルコキシカルボニル基:
 - F8)フェニルC1~6アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい):
- 10 F9) 一般式 (Fa) で表される基:

25

$$-CH_2CH_2-N$$
 $N-R^{21}$
(Fa)

(ここで、R²¹は、C1~6アルコキシカルボニル基;フェニルC1~6アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)又はフェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)を示す。);

F10) 一般式 (Fb) で表される1-置換-4-ピペリジル基:

$$N-R^{22}$$
 (Fb)

(ここで、 R^{22} は、 $C1\sim6$ アルコキシカルボニル基;フェニル $C1\sim6$ アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは

未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)又はフェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基又はハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)を示す。):又は

F11) ピペリジルC1~6アルキル基(ピペリジン環上には、少なくとも1個のフェノキシ基(フェニル環上には、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい)が置換していてもよい)

10 を示す。;

F12)更に、 R^{19} 及び R^{20} は、これらが隣接する窒素原子と共に、他のヘテロ原子もしくは炭素原子を介し又は介することなく互いに結合して下記(F12-1)~(F12-10)に示す複素環を形成していてもよい。;

(F12-1) 一般式 (F c) で表される基:

$$-N$$
 R^{23} (Fc)

15

[ここで、点線は二重結合であってもよいことを示す。 R ²³は、

(Fc1) C1~6アルキル基;

(Fc2) フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

(Fc3) フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子;ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基;ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基;置換基としてC1~6アルキル基及びフェニルC1~6アルキル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]からなる群より選ばれる基を有することのあるアミノ基;フェノキシ基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲ

ン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]、フェニルC1~6アルコキシ基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]及びピペリジル基[ピペリジン環上には、少なくとも1個のアミノ基が置換していてもよい。該アミノ基上には、フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)及びC1~6アルキル基な

- 10 選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)及びC1~6アルキル基なる群より選ばれる基の少なくとも1種が置換していてもよい。]からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
 - (Fc4) フェニル $C1\sim6$ アルコキシ基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換
- 15 の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1 種が置換していてもよい);
 - (Fc5) ビフェニリルC1~6アルコキシ基;
 - (Fc6) フェニル環上に少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよいフェニルC $3\sim6$ アルケニルオキシ基:
- 20 (Fc7)フェノキシ基(フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1 種が置換していてもよい);
- (Fc8) ベンゾイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは 25 未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい); (Fc9) C1~6アルコキシカルボニル基:
 - (Fc10) フェニル $C1\sim6$ アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基が少なくとも 1 個置換していても

よい);

- (Fc11) フェニル環上に少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよいフェニル $C1\sim6$ アルキルカルバモイル基;
- (Fc12) フェニルカルバモイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン 置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい):
 - (Fc13) フェニルチオ基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基が少なくとも1個置換していてもよい):
- 10 (Fc14) フェニルスルホキシド (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基が少なくとも 1 個置換していてもよい);

(Fc15) ピリジルC1~6アルコキシ基:

又は

25

(Fc16) 一般式 (F c a) で表される基:

 $- (C=O) o-NR^{24}R^{25}$ (F c a)

(式中、oは前記に同じ。R²⁴及びR²⁵は、各々

(Fcal) 水素原子;

(Fca2) C1~6アルキル基:

(Fca3) フェニルC 1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハ 20 ロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置 換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい):

(Fca4)フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン 置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1 種が置換していてもよい):

(Fca5) C1~6アルカノイル基;

(Fca6) フェニル環上に少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよいフェニルC2~6アルカノイル基;

(Fca7) ベンゾイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

5 (Fca8) C1~6アルコキシカルボニル基:

(Fca9)フェニルC $1\sim6$ アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC $1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC $1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい);

10 (Fca10) フェニルカルバモイル基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは 未置換のC1~6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい); 又は

(Fcall) ピペリジルオキシカルボニル基(ピペリジン環上には、置換基としてフェニル基[フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル 基が少なくとも1個置換していてもよい] が少なくとも1個置換していてもよい。)

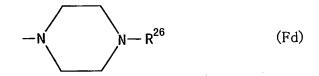
を示す。;

(Fca12) R ²⁴及びR ²⁵は、これらが隣接する窒素原子を介して5~6員環の飽和複素環を形成してもよい。該複素環上には、C1~6アルコキシカルボニル基;ベンゾイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);フェノキシ基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);フェニルC1~6アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン間子の飽きないます。

換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);フェニルC2~6アルケニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)及びフェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)

10 を示す。];

F12-2) 一般式 (Fd) で表される4-置換-1-ピペラジニル基:



15 (式中、R²⁶は、

25

- (Fd1) 水素原子;
- (Fd2) C1~6アルキル基;
- (Fd3) C3~8シクロアルキル基;
- (Fd4) C3~8シクロアルキルC1~6アルキル基;
- 20 (Fd5) C1~6アルコキシカルボニルC1~6アルキル基;
 - (Fd6) フェニルC2~6アルケニル基;
 - (Fd7) フェニルC1~6アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子;シアノ基;ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基; C3~8シクロアルキル基;ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基; 置換基としてC1~6アルキル基を有することのあるアミノ基; C1~6アルコキシカルボニル基;フェノキシ基;フェニルC1~6アルキル基;フェニルC2~6アルケニル

基;ピリジル基;イミダブリル基及びピペリジル基からなる群より選ばれた基が 1~3個置換していてもよい);

(Fd8) ビフェニリルC1~6アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハ

ロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基及び置換基として $C1\sim6$ アルキル基を有することのあるアミノ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

- 5 (Fd9) ナフチルC1~6アルキル基;
 - (Fd10) フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子;シアノ基;置換基としてC1~6アルキル基を有することのあるアミノ基;ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ 換のC1~6アルキル基;ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ 基;C1~6アルコキシカルボニル基;カルボキシル基;フェノキシ基[フェニ
- 10 ル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及 びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた 基の少なくとも1種が置換していてもよい];アミノC1~6アルキル基[アミノ基上にはフェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしく は未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコ
- 15 キシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)及び C1~6アルキル基からなる群より選ばれた基を少なくとも1種が置換していて もよい]及びフェニルC1~6アルコキシ基[フェニル環上には、ハロゲン原子、 ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置 換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換し
- 20 ていてもよい]からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
 - (Fd11) ビフェニリル基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい);
- (Fd12) アミノ基、C1~6アルコキシカルボニル基が置換したアミノ基、フェ 25 ニルC1~6アルキルアミノ基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置 換C1~6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい) 又はフェニルアミノ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

(Fd13) ベンゾイルC1~6アルキル基 (フェニル環上には、少なくとも1個の ハロゲン原子が置換していてもよい);

(Fd14) フェニルカルバモイルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよ い):

(Fd15) チアゾリルC $1\sim6$ アルキル基(チアゾール環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基及び C $1\sim6$ アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい);

(Fd16) オキサゾリルC1~6アルキル基(オキサゾール環上には、ハロゲン置

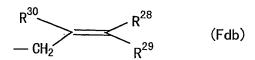
- 10 換もしくは未置換のフェニル基及びC1~6アルキル基からなる群より選ばれた 基の少なくとも1種が置換していてもよい);
 - (Fd17) インドリルC1~6アルキル基;
 - (Fd18) フリルC1~6アルキル基(フラン環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基が少なくとも1個置換していてもよい);
- 15 (Fd19) イミダゾリルC1~6アルキル基(イミダゾール環上には、フェニル基 が置換していてもよい);
 - (Fd20) キノリルC1~6アルキル基;
 - (Fd21) テトラゾリル基 (テトラゾール環上には、フェニル基が置換していてもよい);
- 20 (Fd22) フェニル基が置換していてもよいピリミジル基;
 - (Fd23) ピリジル基;
 - (Fd24) ベンゾオキサゾリル基;
 - (Fd25) ベンゾチアゾリル基;
 - (Fd26) ベンゾオキサゾリルC1~6アルキル基 (ベンゾオキサゾール環上には、
- 25 少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい);
 - (FD27) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェノキシC2~6 アルカノイル基;
 - (Fd28) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェニルチオC2~6アルカノイル基;

(Fd29) フェニルC 2~6 アルカノイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい):

- 5 (Fd30) ベンゾイル基 (フェニル環上にはハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは 未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキ シ基及び置換基としてC1~6アルキル基を有することのあるアミノ基からなる 群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
 - (Fd31) ビフェニリルカルボニル基:
- 10 (Fd32) ピリジルカルボニル基;
 - (Fd33) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェニルC2~6アルケニルカルボニル基;
 - (Fd34) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェニルC1~6アルキルスルホニル基;
- 15 (Fd35) ベンゼンスルホニル基 (ベンゼン環上には、ハロゲン原子及びC1~6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
 - (Fd36) 一般式 (Fda) で表される基:

$$-COOR^{27}$$
 (Fda)

- 20 (式中、R²⁷は、
 - (Fda1) ハロゲン置換もしくは未置換のC1~8アルキル基:
 - (Fda2) C3~C8シクロアルキル基;
 - (Fda3) C3~C8シクロアルキル-C1~6アルキル基:
 - (Fda4) C1~6アルコキシ-C1~6アルキル基;
- 25 (Fda5) C1~6アルキル基を有することのあるアミノーC1~6アルキル基;
 - (Fda6) 一般式 (Fdb) で表される基



(ここで R^{28} 、 R^{29} 及び R^{30} は、各々水素原子; $C1\sim6$ アルキル基;フェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]を示す。);

- 5 (Fda7) フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキルチオ基、フェニルC1~6アルコキシ基、ヒドロキシ基、C1~6アルキルスルフィニル基、C1~6アルキルスルホニルオキシ基、
- 10 シアノ基、C1~6アルカノイル基、ベンゾイル基、アルキル部分にC1~6アルコキシ基を有することのあるフェニルC1~6アルキル基、アミノ基、ニトロ基、カルバモイル基、C1~6アルカノイルアミノ基、C1~6アルコキシカルボニル基、C1~6アルキルアミノカルボニル基、C1~6アルコキシカルボニルアミノ基、トリC1~6アルキルシロキシ基、ピロリル基、テトラヒドロピラコルオキシ基及びイミダゾリル基からなる群より選ばれた基が1~5個置換していてもよい):

(Fda8) ビフェニリルC1~6アルキル基:

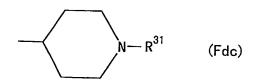
(Fda9) ベンズヒドリル基 (ベンゼン環上には、ハロゲン原子、トリフルオロメチル基及びトリフルオロメトキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも120 種が置換していてもよい):

(Fda10)フェノキシC $1\sim6$ アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC $1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC $1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい);

25 (Fda11) フェニルC 2~6 アルキニル基 (フェニル環上には、ハロゲン置換も しくは未置換のC1~6 アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい);

(Fda12) ピリジルC1~6アルキル基:

(Fda13) 一般式 (Fdc) で表される基



(ここで、R³¹は、フェニル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、 ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい];フェニルC1~6アルキル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種 が置換していてもよい]又はベンゾイル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]を示す。);

(Fda14) ピペリジノC1~6アルキル基(ピペリジン環上には、フェニル環上 15 に置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のアルキル基を少なくとも1個有す ることのあるフェノキシ基が置換していてもよい):

(Fda15) アミノC1~6アルキル基(アミノ基上には、C1~6アルキル基及 びフェニル環上に置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキ シ基を有することのあるフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種 20 が置換していてもよい):

(Fda16) 1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジルC1 \sim 6アルキル基 (1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン環上には、少なくとも1個のフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1 \sim 6アルコキシ基が少なくとも1個置換していてもよい]が置換していてもよい);

25 (Fda17) ナフチルC1~6アルキル基;

(Fda18) フルオレニルC1~6アルキル基;

(Fda19) ピリジルC1~6アルキル基;

(Fda20) フリルC1~6アルキル基 (フラン環上には、ハロゲン置換もしくは 未置換のフェニル基が置換していてもよい) ; 10

15

25

(Fda21) チエニルC1~6アルキル基;

(Fda22) オキサゾリルC1~6アルキル基(オキサゾール環上には、ハロゲン原子又はハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基が置換していてもよい);

(Fda23) オキサジアゾリルC1~6アルキル基(オキサジアゾール環上には、

5 ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基が置換していてもよい);

(Fda24) ピラゾリルC1~6アルキル基(ピラゾール環上には、ハロゲン置換 もしくは未置換のフェニル基が置換していてもよい);

(Fda26) チオフェン環上にハロゲン原子が置換していてもよいチエニルC1~6アルキル基;

(Fda27) ベンゾチアゾリルC1~6アルキル基;

(Fda28) ベンゾフラン環上にハロゲン原子が置換していてもよいベンゾフリル C1~6アルキル基;

(Fda29) インドリニルC $1 \sim 6$ アルキル基(インドリン環上には、C $1 \sim 6$ アルキル基及びオキソ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい);

(Fda30) ベンゾオキサゾリルC1~6アルキル基 (ベンゾオキサール環上には、20 ハロゲン原子、C1~6アルキル基及びオキソ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

(Fda31) クロメニル $C1\sim6$ アルキル基;

(Fda32) 1, 2, 3, 4ーテトラヒドロキノリル $C1\sim6$ アルキル基(キノリン環上には、 $C1\sim6$ アルキル基及びオキソ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

(Fda33) チアゾリル $C1\sim6$ アルキル基(チアゾール環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基及び $C1\sim6$ アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

又は

(Fda34) テトラゾリルC1~6アルキル基(テトラゾール環上には、ハロゲン 置換もしくは未置換のフェニル基及びC1~6アルキル基からなる群より選ばれ た基の少なくとも1種が置換していてもよい)

を示す。);

5 (Fd37) 一般式 (Fe) であらわされる基:

$$-Z - NR^{32}R^{33}$$
 (Fe)

(式中、Zは-C=O又は-C=Sを示す。 R^{32} 及び R^{33} は、同一又は異なって、

- (Fe1) 水素原子:
- 10 (Fe2) C1~6アルキル基:
 - (Fe3) C3~8シクロアルキル基:
 - (Fe4) フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい):
 - (Fe5) フェニルC 2~6 アルケニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい):
- 20 又は

15

- (Fe6) フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1 種が置換していてもよい)を示す。:
- 25 (Fe7) 或いは、R ³² 及びR ³³ は、これらが隣接する窒素原子と共に他の炭素原子を介して互いに結合してピペリジン環又は1,2,3,6ーテトラヒドロピリジン環を形成してもよい。該ピペリジン環及び1,2,3,6ーテトラヒドロピリジン環上には、フェニル基が置換してもよく、該フェニル基にはハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基からなる群より選ば

15

20

れた基の少なくとも1種が置換していてもよい。);

(Fd38) 一般式 (Ff) で表される基:

$$-N = C < R^{34}$$
 (Ff)

5 (式中、 R^{34} は水素原子又は $C1\sim6$ 低級アルキル基を示す。 R^{35} は、

- (Ff1) C3~8シクロアルキル基;
- (Ff2) C3~8シクロアルケニル基;
- (Ff3) 一般式 (F f a) で表される基:

(ここで、R³⁶、R³⁷及びR³⁸は、各々水素原子;C1~6アルキル基;フェール基[フェール環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基、C1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基、C1~4アルキレンジオキシ基、C1~6アルキルスルホニル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキルチオ基、ニトロ基及び置換基としてC1~6アルカノイル基を有することのあるアミノ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が1~5個置換していてもよい];ベンゾフリル基[ベンゾフラン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい];ビフェニリル基、フリル基[フラン環上には、置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル基が置換していてもよい]又はチアゾリル基[チアゾール環上には、ハロゲン原子を有することのあるフェニル基が少なくとも1個置換していてもよい]を示す。);

25 (Ff4) フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子; ハロゲン置換もしくは 未置換のC1~6のアルキル基; C3~8シクロアルキル基; ヒドロキシル基; ハロゲン置換もしくは未置換のC1~8のアルコキシ基; C3~8シクロアルコ キシ基; C1~4アルキレンジオキシ基; シアノ基; ニトロ基; フェニルC2~ 6アルケニル基; C2~6アルカノイルオキシ基; 置換基としてC1~6アルカ

ノイル基を有することのあるアミノ基;C 1 ~ 6 アルキルスルホニルアミノ基; フェニルC1~6アルコキシ基;フェノキシ基;C1~6アルキル基が少なくと も1個置換したアミノ基;フェニル基が少なくとも1個置換したアミノ基;アミ ノC1~6アルコキシ基[アミノ基上には、C1~6アルキル基が少なくとも1 個置換していてもよい];C1~6アルコキシカルボニル基;C1~6アルコキ シカルボニルC1~6アルコキシ基; C1~6アルキルチオ基; ピロリル基; イ ミダゾリル基;ピペリジル基;モルホリノ基;ピロリジニル基;チエニル基;ベ ンゾフリル基:ピペラジニル基[ピペラジン環上には、置換基としてC1~6ア ルキル基、フェニルC1~6アルキル基及びC1~6アルキル基を少なくとも1 10 種有することのあるベンゾイル基からなる群より選ばれた基が少なくとも1種置 換していてもよい〕;キノリル基[キノリン環上にC1~6アルコキシ基及びオ キソ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい];ピ ペリジン環上にカルボスチリル基が置換していてもよいピペリジルカルボニル基 及びトリアゾリル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していて 15 もよい);

(Ff5)ナフチル基(ナフタレン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基及び置換基として $C1\sim6$ アルキル基を有することのあるアミノ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1 種が置換していてもよい);

- 20 (Ff6) ビフェニリル基 (ビフェニリル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換 もしくは未置換のC1~9アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~ 6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよ い);
 - (Ff7) フルオレニル基: ピレニル基:
- 25 (Ff8) ベンゾフリル基 (ベンゾフラン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換 もしくは未置換のC1~6アルキル及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよ い);
 - (Ff9) ベンゾチエニル基(ベンゾチオフェン環上には、ハロゲン原子、ハロゲ

25

ン置換もしくは未置換のC1~6アルキル及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

(Ff10) ピリジル基(ピリジン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、フェニル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が少なくとも1種が置換していてもよい]、フリル基及びチエニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

- 10 (Ff11) フリル基 (フラン環上には、C1~6のアルキル基、ニトロ基及びフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6のアルコキシ基及びニトロ基からなる群より選ばれた基が少なくとも1種が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい):
- 15 (Ff12) ベンゾチアゾール基 (ベンゾチアゾール環上には、置換基としてフェニル環上にC1~6のアルコキシ基を有することのあるフェニル基が少なくとも1個置換していてもよい);

(Ff13) チエニル基 (チオフェン環上には、ハロゲン原子、ニトロ基、C1~6アルキル基、ピラゾール環上にハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキ20 ル基が少なくとも1個置換していてもよいピラゾリル基及びチオフェン環上にハロゲン原子が置換していてもよいチエニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

(Ff14) インドリル基(インドール環上には、置換基としてC1~6アルキル基を有することのあるフェニルスルホニル基、フェニルC1~6アルキル基、C1~6アルコキシカルボニル基及びフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

(Ff15) ピロリル基(ピロール環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1 ~6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよいフェニル基及びC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい):

(Ff16) クマリル基:

(Ff17) ベンゾイミダゾリル基 (ベンゾイミダゾール環上には、少なくとも1個のチエニル基が置換していてもよい) ;

(Ff18) オキサゾリル基 (オキサゾール環上には、ハロゲン原子を有すること のあるフェニル基が少なくとも1個置換していてもよい) ;

(Ff19) チアゾリル基 (チアゾール環上には、少なくとも1個のフェニル基が 置換していてもよい。該フェニル環上には、ハロゲン原子、ニトロ基及びフェニ ル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。);

(Ff20) キノリル基:

10 (Ff21) 3, 4ージヒドロカルボスチリル基(3, 4ージヒドロカルボスチリル環上には、C1~6アルコキシ基、C1~6アルキル基及びフェニルC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)、カルボスチリル基(カルボスチリル環上には、C1~6アルコキシ基、C1~6アルキル基及びフェニルC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基15 の少なくとも1種が置換していてもよい):

(Ff22) イミダゾ [2, 1-b] チアゾリル基;

(Ff23) イミダゾ [2, 1-a] ピリジル基:

(Ff24) クロマニル基(クロマン環上には、少なくとも1個の $C1\sim6$ アルキル基が置換していてもよい);

20 又は

(Ff25) 2, 3-ジヒドロベンゾフリル基

を示す。);

又は

(Fd39) 一般式 (Ffb) で表される基:

$$-\sqrt{N-R^{45}}$$
 (Ffb)

(式中、 R^{45} は、 $C1\sim6$ アルコキシカルボニル基;フェニル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の

少なくとも1種が置換していてもよい];アミノ置換C1~6アルキル基[アミ ノ基上には、フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もし くは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アル コキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)及 びC1~6アルキル基なる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していても よい : ベンゾイル基「フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしく は未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコ キシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい];フ ェニルC1~6アルキル基「フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換も しくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6ア 10 ルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよ い];フェニルC1~6アルコキシカルボニル基[フェニル環上には、ハロゲン 原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしく は未置換のС1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が 置換していてもよい]又はフェニルC2~6アルケニル基[フェニル環上には、 15 ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置 換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくと も1種が置換していてもよい]を示す。)

を示す。)

20 F12-3) モルホリノ基;

F12-4) イミダゾリル基;

F12-5) 1, 4-ジオキサアザスピロ [4, 5] デシル基(1, 4-ジオキサア ザスピロ [4, 5] デカン環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していて もよい);

25 F12-6) ホモピペラジニル基 (ホモピペラジン環上には、C1~6アルコキシカルボニル基、フェニルC1~6アルコキシカルボニル基及びフェニル置換もしくは未置換のフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

F12-7) ピペラジニル基 (ピペラジン環上には、オキソ基、C1~6アルキル基、

フェニル $C1\sim6$ アルキル基 [フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基の少なくとも1個が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

F12-8) ピペリジル基(ピペリジン環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換 5 していてもよい);

F12-9)ピロリジニル基(ピロリジン環上には、置換基としてハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基を有することのあるフェノキシ $C1\sim6$ アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい);

又は

10 F12-10) イソインドリニル基

を示す。;

F13)更に、 R^{19} 及び R^{20} は、これらが隣接する窒素原子と共にヘテロ原子を介しもしくは介することなく互いに結合して、下記(F13-1)~(F13-11)に示す環状イミド又はアミドを形成していてもよい。

15 (F13-1) スクシンイミド基:

(F13-2) オキサゾリジニル基 (オキサゾリジン環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい):

(F13-3) ベンゾー1, 3ーオキサゾリジニル基(ベンゾー1, 3ーオキサゾリジン環上には、オキソ基、ハロゲン原子及びフェニル基からなる群より選ばれた 20 基の少なくとも1種が置換していてもよい):

(F13-4) イミダゾリジニル基(イミダゾリジン環上には、オキソ基、フェニル $C1\sim6$ アルキル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子及び $C1\sim6$ アルコキシ 基からなる群より選ばれた基が $1\sim3$ 個置換していてもよい] 及びフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ;

25 (F13-5) ベンゾイミダブリジニル基 (ベンゾイミダブリジン環上には、オキソ 基、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、置換基 としてC1~6アルキル基を有することのあるアミノ基、C1~6アルコキシカ ルボニル基及びピペリジル基 [ピペリジン環上には、C1~6アルキル基、フェ ニル環上にハロゲン原子が1~3個置換していてもよいフェニル基、C1~6ア ルコキシカルボニル基及びフェニルC1~6アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]からなる群より選ばれた基を少なくとも1種が置換していてもよい);

(F13-6) フタルイミド基:

5 (F13-7) インドリニル基 (インドリン環上には、C1~6アルキル基、ハロゲン原子及びオキソ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

(F13-8) 2, 3 - ジヒドロベンゾチアゾリル基(2, 3 - ジヒドロベンゾチア ゾール環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい);

10 (F13-9) 1 H-2, 4-ベンゾオキサジニル基(1 H-2, 4-ベンゾオキサ ジン環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい);

(F13-10) 一般式 (Fga) で表される基:

$$0 \longrightarrow 0 \\ \mathbb{R}^{39}$$
 (Fga)

15 (式中、R³⁹は、水素原子;フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニルC1~6アルキル基;フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェノキシC1~6アルキル基;フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニルC2~6アルケニル基;フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基及びフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよいフェニル基;ピリジル基又はピラジニル基を示す。)

(F13-11) 1, 3-チアゾリジニル基(1, 3-チアゾリジン環上には、置換基としてオキソ基及びフェニル環上にハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキ25 ル基を有していてもよいフェニルC1~6アルキリデン基からなる群より選ばれる基の少なくとも1種が置換していてもよい。)

一般式(G)で表される基:

1030

(式中、 R^{40} は、 $C1\sim6$ アルキル基又はハロゲン置換もしくは未置換のフェ 5 ニル基を示す。)

一般式(H)で表されるスピロ環基:

10 (式中、R⁴¹は、

- H1) 水素原子;
- H2) C1~6アルキル基:
- H3) フェニル環上に置換基としてフェニル基を有することのあるフェニルC1~6アルキル基;
- 15 H4) フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基、アミノ基[アミノ基上には、C1~6アルキル基及びフェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]、フェノキシ基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]及びピペリジル基[ピペリジン環上には、少なくとも1個のフェ25 ノキシ基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)が置換していてもよい]からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)が置換していてもよい)が
 - H5) ピペラジニルC1~6アルキル基 (ピペラジン環上には、C1~6アルコキ

シカルボニル基及びフェニルC1~6アルコキシカルボニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基及びフェニル基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい]からなる群より選ばれた基の少なくと

- 5 も1種が置換していてもよい);
 - H6)ピペラジニルカルボニルC1~6アルキル基(ピペラジン環上には、C1~6アルコキシカルボニル基、フェニル環上に置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基を有していてもよいフェニルC1~6アルコキシカルボニル基及びフェニルC1~6アルキル基[フェニル環上には、ハロゲン置換
- 10 もしくは未置換のC1~6アルキル基及びフェニル基からなる群より選ばれた基 の少なくとも1種が置換していてもよい]からなる群より選ばれた基の少なくと も1種が置換していてもよい);
 - H7) フェニルカルバモイルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよ
- $15 \ V)$;
 - H8) ベンゾオキサゾリルC1~6アルキル基(ベンゾオキサゾール環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい):
 - H9) ベンゾチアゾリル基:
- H10) テトラゾリル基 (テトラゾール環上には、少なくとも1個のフェニル基が 20 置換していてもよい):
 - H11) C1~6アルキルスルホニル基:
 - H12) フェニルスルホニル基 (フェニル環上には、少なくとも1個のC1~6アルキル基が置換していてもよい);
- H13) フェニルチオカルバモイル基 (フェニル環上には、少なくとも1個のハロ 25 ゲン原子が置換していてもよい);
 - H14) C1~8アルコキシカルボニル基;
 - H15) フェニルC1~6アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、C1~6アルコキシカルボニル基、置換基としてC1~6アルコキシカルボニル基を有していてもよいアミノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6

アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基、ニトロ基及び $C1\sim6$ アルキルチオ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1 種が置換していてもよい);

- H16) ベンズヒドリルオキシカルボニル基 (フェニル環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい);
 - H17) フェニル置換もしくは非置換のフェニル $C1\sim6$ アルコキシカルボニル基;
 - H18) ナフチルC1~6アルコキシカルボニル基:
 - H19) ピリジルC1~6アルコキシカルボニル基;
- 10 H20) C1~6アルコキシ置換C1~6アルコキシカルボニル基;
 - H21) ピペラジニルC1~6アルコキシカルボニル基 (ピペラジン環上には、C1~6アルコキシカルボニル基及びフェニルC1~6アルコキシカルボニル基 [フェニル環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい):
- 15 H22) フェノキシカルボニル基(フェニル環上には、 $C1\sim6$ アルキル基及びC $1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい);
 - H23) C1~6アルカノイル基:
 - H24) ベンゾイル基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~
- 20 6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい);
 - H25) フェニル $C1\sim6$ アルカノイル基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基が少なくとも1 個置換していてもよい);
 - H26) フェノキシ $C1\sim6$ アルカノイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子が $1\sim3$ 個置換していてもよい);
- 25 H27) ピペラジニルC 2~6アルカノイル基 (ピペラジン環上には、C 1~6アルカノイル基、フェニルC 1~6アルキル基 [フェニル環上には、フェニル基、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基を少なくとも1種が置換していてもよい]、フェニルC 1~6アルコキシカルボニル基

[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基を少なくとも1種が置換していてもよい]、フェニルカルバモイルC1~6アルキル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくはま置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基を少なくとも1種が置換していてもよい]、フェニルカルバモイル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基を少なくとも1種が置換していてもよい]及10 びベンゾオキサゾリル基からなる群より選ばれた基を少なくとも1種が置換していてもよい]及10 びベンゾオキサゾリル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい):

- H28) フェニルカルバモイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、置換基としてC1~6アルキル基を有することのあるアミノ基、カルボキシル基、C1~6アルコキシカルボニル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、
- 15 ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基、ピペラジン環上に置換基 としてC1~6アルキル基を有することのあるピペラジニル基及びモルホリノ基 からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい);
 - H29) フェニルC1~6アルキルカルバモイル基(フェニル環上には、ハロゲン 置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していて もよい);

又は

20

H30) ピペラジニルカルボニル基 (ピペラジン環上には、C1~6アルコキシカルボニル基、フェニルC1~6アルコキシカルボニル基 [フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい] 及びフェニルC1~6アルキル基 [フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい] からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)を示す。)

但し、 R^1 が水素原子を示し、 R^2 が一般式(A)で表される基を示す場合、 R^3 はイソプロピル基であってはならない。また、 R^1 が水素原子を示し、 R^2 が一般式(E)で表される基を示し、Mが 0を示す場合、 R^{11} は水素原子であってはならない。更に、 R^1 が水素原子を示し、 R^2 が一般式(E)で表される基を示す場合、 R^2 が一般式(E)で表される基を示す場合、 R^{19} は水素原子を示し且の R^{20} がEであってはならない。E0。基を示してはならない。E1。

2. 一般式 (1')

$$O_2N$$
 R^1
 $(CH_2)_nR^2$
 $(1')$

10

で表される請求項1に記載の2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩:

(式中、 R^1 は水素原子又は $C1\sim6$ アルキル基を示す。nは $0\sim6$ の整数を示 15 す。 R^2 は下記一般式(A')、(B')、(C')、(D')、(E')、(F')又は(G')で表される基を示す。また、 R^1 及びー(CH_2) $_nR^2$ は、隣接する炭素原子と共に窒素原子を介して互いに結合して下記一般式(H')で表されるスピロ環を形成していてもよい。)

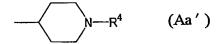
一般式(A')で表される基;

 $-OR^{3} \qquad (A')$

(式中、R³は

- A1) 水素原子:
- A2) C1~6アルキル基:
- A3) C1~6アルコキシ-C1~6アルキル基;
- 25 A4) フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ベンジルオキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
 - A5) ビフェニリルC1~6アルキル基;

- A6) シンナミル基;
- A7) メタンスルホニル基;
- A8) メチル基が置換していてもよいベンゼンスルホニル基;
- A9) C1~6アルカノイル基;
- 5 A10) 一般式 (Aa') で表される基:



(ここでR⁴は、C1~6アルコキシカルボニル基;フェニルC1~6アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ベンジルオキシ基、ハロゲン置換もしくは10 未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)又はフェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ベンジルオキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していて15 もよい)を示す。)

- A11) ビフェニリル $C1\sim6$ アルコキシカルボニル基;
- A12) 2-(2-オキソー3-ベンゾオキサゾリル)エチル基:
- A13) 2-ベンゾオキサゾリル基:
- A14) 2-フェニル-5-メチル-4-オキサゾリルメチル基;
- 20 一般式(B')で表される基;

$$-SR5$$
 (B')

(式中、 R^5 は、5-(1H) ーテトラゾリル基($1位がC1\sim6$ アルキル基又はハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基で置換していてもよい)又は2-ベンゾオキサゾリル基を示す)、

25 一般式 (C') で表される基;

$$-COOR^6$$
 (C')

(式中、R⁶はC1~6アルキル基を示す。)

一般式 (D') で表されるカルバモイルオキシ基;

$$-OOCNR^7R^8$$
 (D')

(式中、 R^7 及び R^8 は、同一又は異なって、

- D1) 水素原子;
- D2) C1~8アルキル基;
- D3) ハロゲン置換C1~6アルキル基;
- 5 D4) C1~6アルコキシカルボニルC1~6アルキル基:
 - D5) C5~8シクロアルキル基:
 - D6) フェニル $C1\sim6$ アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1 種が置換してい
- 10 てもよい):
 - D7) フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基、C1~6アルカノイル基、カルボキシル基、C1~6アルコキシカルボニル基、ベンジルオキシカルボニル基、カルバモイル基、C1~6アルキルカルバモイル基、アミノスルホニル基及びモルホリノ基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい):
 - D8) 1-ナフチル基:
 - D9) 4-ピリジル基:
- D10) R⁷及びR⁸は、隣接するN原子と共に、他のヘテロ原子もしくは炭素原 20 子を介し又は介することなく互いに結合して下記(D10-1)~(D10-3)に示す飽和複 素環基又は下記(D10-4)~(D10-7)に示すベンゼン縮合複素環基を形成していても よい。
 - (D10-1) 一般式 (Da') で示されるピペラジニル基;

25

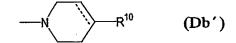
(ここでR⁹は

- (Dal) 水素原子;
- (Da2) C1~6アルキル基:
- (Da3) フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロ

ゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

- (Da4) フェニル基(フェニル環上にハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置 換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ 基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) :
 - (Da5) C1~6アルコキシカルボニル基;
- (Da6) フェニル $C1\sim6$ アルコキシカルボニル基(フェニル環上にハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしく は未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
 - (Da7) 4-トリフルオロメチルシンナミルオキシカルボニル基;又は
 - (Da8) 4-トリフルオロメチルベンジリデンアミノ基を示す。)
 - (D10-2) 一般式 (Db') で示される基;

15



(式中、点線は二重結合であってもよいことを示す。 R 10 は

- (Db1) 水素原子;
- (Db2) フェニル基 (フェニル環上にハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置 20 換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ

基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

- (Db3) フェノキシ基(フェニル環上にハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基の少なくとも1種が置換していてもよい);又は
- (Db4) フェニルアミノ基 (フェニル環上にハロゲン置換もしくは未置換のC1 25 ~6アルキル基の少なくとも1種が置換していてもよい)を示す。)
 - (D10-3) モルホリノ基:
 - (D10-4) ハロゲン置換もしくは未置換の1-インドリニル基;
 - (D10-5) ハロゲン置換もしくは未置換の2-イソインドリニル基;
 - (D10-6) ハロゲン置換もしくは未置換の1,2,3,4ーテトラヒドロー1

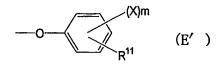
1038

ーキノリニル基;

(D10-7) ハロゲン置換もしくは未置換の1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリニル基を示す。)

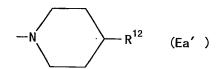
一般式(E')で表されるフェノキシ基;

5



(式中、Xはハロゲン原子を示す。mは $0\sim3$ の整数を示す。 R^{11} は

- E1) 水素原子;
- 10 E2) ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基;
 - E3) ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基;
 - E4) モルホリノ基:
 - E5) チオモルホリノ基:
 - E6) S-オキシドチオモルホリノ基:
- 15 E7) 1-イミダゾリル基:
 - E8) 1-トリアゾリル基;
 - E9) 一般式(Ea')で示されるピペリジニル基:



- 20 (式中、R¹²は
 - (Ea1) 水素原子:
 - (Ea2) C1~6アルコキシカルボニル基;又は
 - (Ea3) フェノキシ基(フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン 置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC
- $1 \sim 6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1 種が置換していてもよい)を示す。)

E10) 一般式 (E b') で表される基:

$$-(C=O)_k$$
 $N-R^{15}$ (Eb')

(式中、kは0又は1を示す。R¹⁵は

- 5 (Eb1) 水素原子;
 - (Eb2) C1~6アルキル基;
 - (Eb3) フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種
- 10 が置換していてもよい);

25

- (Eb4) フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1 種が置換していてもよい);
- 15 (Eb5) C1~6アルカノイル基;
 - (Eb6) フェニルC 2~6 アルカノイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい):
- 20 (Eb7) ベンゾイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい); (Eb8) C1~8のアルコキシカルボニル基 (アルコキシ基上には、ハロゲン原子、ジ (C1~6アルキル) アミノ基及びC1~6アルコキシ基からなる群より

選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

(Eb9) フェニル $C1\sim6$ アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

(Eb10) フェニルC 3~6Pルケニルオキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6Pルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6Pルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

5 (Eb11) フェノキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン 置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していて もよい);

(Eb12) フェニルC1~6アルキルカルバモイル基(フェニル環上には、ハロゲ 10 ン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1 種が置換していてもよい):

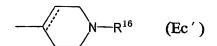
(Eb13) フェニルカルバモイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン 置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);又は

(Eb14) ベンゼン環上にハロゲン原子が置換していてもよい2ーベンゾフラニルメチルオキシカルボニル基を示す。)

E11) 一般式 (E c') で表される基:

20

15



(式中、点線は二重結合であってもよいことを示す。 R 16 は

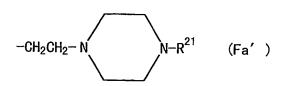
- (Ec1) 水素原子;
- (Ec2) C1~6アルキル基;
- 25 (Ec3) フェニルC 1~6アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい):
 - (Ec4) C1~8のアルコキシカルボニル基;又は

- (Ec5) フェニルC $1\sim6$ アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC $1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC $1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)を示す。)
- 5 一般式 (F') で表される基:

$$-NR^{19}R^{20}$$
 (F'

[式中、R¹⁹及びR²⁰は、同一又は異なって

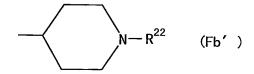
- F1) 水素原子;
- F2) C1~6アルキル基;
- 10 F3) フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン ン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基及びジメチルアミノ基からなる群より選ばれた基の少なくと も1種が置換していてもよい);
 - F4) フェノキシC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロ
- 15 ゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
 - F5) N-メチルアミノC1~6アルキル基(N位には、C1~6アルコキシカルボニル基或いはフェニル環上にハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換
- 20 のC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよいフェニル基が置換してもよい);
 - F6) フェニル基(フェニル環上にハロゲン原子及びC1~6アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
 - F7) C1~6アルコキシカルボニル基;
- 25 F8) フェニルC $1 \sim 6$ アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC $1 \sim 6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC $1 \sim 6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい);
 - F9) 一般式 (Fa') で表される 4-置換-1-ピペラジニルエチル基;



(ここで、R²¹はC1~6アルコキシカルボニル基、フェニルC1~6アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)、フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)又はフェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)を示す。

F10) 一般式 (Fb') で表される1-置換-4-ピペリジニル基;

15

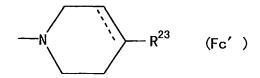


(ここで R^{22} は、 $C1\sim6$ アルコキシカルボニル基;フェニル $C1\sim6$ アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未20 置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);又はフェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)を25 示す。)、又は

- F11) 2-[4-(4-)リフルオロメチルフェノキシ)-1-ピペリジニル] エチル基を示す。
- F12) 更に、 R^{19} 及び R^{20} は、これらが隣接する窒素原子と共に他のヘテロ原子もしくは炭素原子を介しもしくは介することなく互いに結合して下記F12

-1) \sim F12-10) に示す複素環を形成していてもよい。

F12-1) 一般式 (F c') で表される基



5

25

(ここで点線は二重結合であってもよいことを示す。R²³は

- (Fc1) C1~6アルキル基:
- (Fc2) フェニル $C1\sim6$ アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換 の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい):
 - (Fc3) フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは 未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコ キシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
- 15 (Fc4) フェニル $C1\sim6$ アルコキシ基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
 - (Fc5) 4-ビフェニリルC1~6アルコキシ基:
- 20 (Fc6) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェニルC3~6ア ルケニルオキシ基;
 - (Fc7) フェノキシ基(フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン 置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していて もよい):
 - (Fc8) ベンゾイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい); (Fc9) $C1\sim6$ アルコキシカルボニル基;

- (Fc10) フェニル $C1\sim6$ アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基の少なくとも1種が置換していてもよい);
- (Fc11) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェニルC1~6ア 5 ルキルカルバモイル基:
 - (Fc12) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェニルカルバモイル基:
 - (Fc13) フェニルチオ基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基の少なくとも1種が置換していてもよい):
- 10 (Fc14) フェニルスルホキシド基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基の少なくとも1 種が置換していてもよい):
 - (Fc15) ピリジルメトキシ基:又は
 - (Fc16) 式 (Fca') で表される基:

$$-NR^{24}R^{25}$$
 (Fca')

- 15 [式中、R²⁴及びR²⁵は、各々
 - (Fcal) 水素原子:

- (Fca2) C1~6アルキル基:
- (Fca3) フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換して
- 20 の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1 種が置換していてもよい);
 - (Fca4) フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
 - (Fca5) C1~6アルカノイル基;
 - (Fca6) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェニルアセチル基;
 - (Fca7) ベンゾイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしく

は未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい); (Fca8) $C1\sim6$ アルコキシカルボニル基;

(Fca9) フェニルC1~6アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲ ン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1 種が置換していてもよい):

(Fca10) フェニルカルバモイル基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは 未置換のC1~6アルキル基の少なくとも1種が置換していてもよい);又は

10 (Fcall) 1 - (4 - h リ フルオロメチルフェニル) - 4 - ピペリジニルオキシカルボニル基を示す。

(Fca12) R $^{2.4}$ 及びR $^{2.5}$ は、隣接する窒素を介してピペリジン環を形成してもよい。)を示す。]

F12-2) 一般式 (F d') で表される4-置換-1-ピペラジニル基;

15

(式中、R²⁶は

- (Fd1) 水素原子;
- (Fd2) C1~6アルキル基;
- 20 (Fd3) C5~8シクロアルキル基;
 - (Fd4) C5~8シクロアルキル-C1~6アルキル基:
 - (Fd5) C1~6アルコキシカルボニル-C1~6アルキル基;
 - (Fd6) シンナミル基:

(Fd7) フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子;シア 25 ノ基;ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基;シクロヘキシル基; ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基;ジメチルアミノ基;C1 ~6アルコキシカルボニル基;フェノキシ基;フェニルC1~6アルキル基;ス チリル基;3ーピリジル基;1ーイミダゾリル基及び1ーピペリジノ基からなる 群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい);

- (Fd8) ビフェニリルメチル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基及びジメチルアミノ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
- 5 (Fd9) 1-又は2ーナフチルメチル基;
 - (Fd10) フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ジメチルアミノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基、C1~6アルコキシカルボニル基及びカルボキシル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよ
- 10 V);
 - (Fd11) ビフェニリル基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
- (Fd12) アミノ基、C1~6アルコキシカルボニル基が置換したアミノ基、ベン 15 ジルアミノ基、トリフルオロメチルベンジルアミノ基又はフェニルアミノ基 (フェニル環上にはハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン 原子からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
 - (Fd13) 4-クロロベンゾイルメチル基、
 - (Fd14) フェニルカルバモイルメチル基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もし
- 20 くは未置換のC1~6アルキル基の少なくとも1種が置換していてもよい); (Fd15) 4-又は5-チアゾリルメチル基 (チアゾール環上には、ハロゲン置換 もしくは未置換のフェニル基及びC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい):
- (Fd16) 4-オキサゾリルメチル基(オキサゾール環上には、ハロゲン置換もし 25 くは未置換のフェニル基及びC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい):
 - (Fd17) 2-インドリルメチル基;
 - (Fd18) 2-フリルメチル基 (フラン環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基の少なくとも1種が置換していてもよい):

- (Fd19) 4-又は5-イミダゾリルメチル基(イミダゾール環上には、フェニル 基が置換していてもよい);
- (Fd20) 2-キノリルメチル基;
- (Fd21) 5-(1H)ーテトラゾリル基(テトラゾール環の1位には、フェニル
- 5 基が置換していてもよい);
 - (Fd22) フェニル基が置換していてもよい2-又は4-ピリミジル基;
 - (Fd23) 2-、3-又は4-ピリジル基;
 - (Fd24) 2-ベンゾオキサゾリル基;
 - (Fd25) 2 -ベンゾチアゾリル基;
- 10 (Fd26) 2-オキソー3-ベンゾオキサゾリルーC1~6アルキル基;
 - (Fd27) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェノキシC2~6 アルカノイル基;
 - (Fd28) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェニルチオC2~6アルカノイル基;
- - (Fd30) ベンゾイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしく
- 20 は未置換の $C1 \sim 6$ アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1 \sim 6$ アルコキシ基及び $C1 \sim 6$ アルキルアミノ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);
 - (Fd31) 4-ビフェニリルカルボニル基:
 - (Fd32) 2-、3-、又は4-ピリジルカルボニル基;
- 25 (Fd33) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいシンナモイル基;
 - (Fd34) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェニルC1~6アルキルスルホニル基:
 - (Fd35) ベンゼンスルホニル基 (ベンゼン環上には、塩素原子及びメチル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

(Fd36) 一般式 (Fda') で表される基:

 $-COOR^{27}$ (Fda')

(式中R²⁷は

15

20

25

(Fda1) ハロゲン置換もしくは未置換のC1~8のアルキル基;

5 (Fda2) C5~8シクロアルキル基:

(Fda3) C5~8シクロアルキル-C1~6アルキル基:

(Fda4) C1~6アルコキシ-C1~6アルキル基:

(Fda5) C1~6アルキルアミノ-C1~6アルキル基:

(Fda6) 一般式 (Fdb') で表される基

(ここで R^{28} 、 R^{29} 及び R^{30} は、各々水素原子; $C1\sim6$ アルキル基;フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)を示す。)、

(Fda7) フェニル $C1\sim6$ アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキルチオ基、フェニル $C1\sim6$ アルコキシ基、ヒドロキシ基、メチルスルフィニル基、メタンスルホニル基、メタンスルホニルオキシ基、シアノ基、アセチル基、ベンゾイル基、 α 、 α -ジメトキシベンジル基、アミノ基、ニトロ基、カルバモイル基、アセチルアミノ基、 α 0 アルコキシカルボニル基、 α 0 アルキルアミノカルボニル基、 α 1 トリ α 2 アルカルボニル基、 α 3 アミノ基、 α 4 アルカルボニル基、 α 5 アルカルボニル基、 α 5 アルカルボニル基、 α 5 アルカルボニルを、 α 6 アルカルボニルを、 α 6 アルカルボニルを、 α 7 ロリル基、 α 8 アルカルボニルをして α 9 アルカルガルをして α 9 アルカル・ α 9 アル

(Fda8) ビフェニリルC1~6アルキル基:

からなる群より選ばれた基が1~5個置換していてもよい);

(Fda9) ベンズヒドリル基 (ベンゼン環上には、ハロゲン原子、トリフルオロメ チル基及びトリフルオロメトキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種 が置換していてもよい); (Fda10) フェノキシC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

5 (Fdall) 3-(4-トリフルオロメチル)フェニル-2-プロピニル基;

(Fda12) 2-、3-、又は4-ピリジルメチル基;

(Fda13) 一般式 (Fdc') で表される基

- 10 (ここでR³¹は、フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);又はベンゾイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)を示す。)、
- 20 (Fda14) 1-ピペリジノエチル基 (ピペリジン環の4位に4-トリフルオロメ チルフェノキシ基が置換していてもよい);

(Fda15) Nーメチル-N-(4-トリフルオロメトキシ) フェニルアミノエチル基;

(Fda16) 4-(4-)リフルオロメトキシフェニル) -1, 2, 3, 6-テト

25 ラヒドロー1ーピリジニルエチル基;

(Fda17) 1-又は2-ナフチルメチル基;

(Fda18) 1-、2-、3-、4-、又は9-フルオレニルメチル基;

(Fda19) 2-、3-、又は4-ピリジルメチル基;

(Fda20) 2-フリルメチル基(フラン環の4位にハロゲン置換もしくは未置換

のフェニル基が置換していてもよい);

- (Fda21) 3-チエニルメチル基;
- (Fda22) 4ーオキサゾリルメチル基 (オキサゾリン環の 2 位にハロゲン原子又はクロロフェニル基が置換していてもよい) :
- 5 (Fda23) ハロゲン原子が置換していてもよい4ーチアゾリルメチル基;
 - (Fda24) 5-オキサジアゾリルメチル基 (オキサジアゾリン環の 2 位にハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基が置換していてもよい):
 - (Fda25) 3ーピラゾリルメチル基(ピラゾリン環の1位にハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基が置換していてもよい);
- 10 (Fda26) 2-又は3-ベンゾチオフェニルメチル基 (ハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種がベンゼン環上に置換していてもよい) :
 - (Fda27) ベンゼン環上にハロゲン原子が置換していてもよいベンゾオキサゾー ルー2ーイルメチル基;
- 15 (Fda28) ハロゲン原子が置換していてもよい2-チエニルメチル基;
 - (Fda29) 2ーベンゾチアゾリルメチル基:
 - (Fda30) 2- (5-クロロ) ベンゾフラニルメチル基:
 - (Fda31) 3, 3-ジメチル-2-オキソー5-インドリニルメチル基(インドリン環の1位にC1~6アルキル基が置換していてもよい) ;
- 20 (Fda32) $2-オキソー6-ベンゾオキサゾリルメチル基 (ベンゾオキサゾリン 環の1位に<math>C1\sim6$ アルキル基が置換していてもよい) :
 - (Fda33) 7-クロメニルメチル基;
 - (Fda34) 2-オキソー1, 2, 3, $4-テトラヒドロー6-キノリルメチル基 (キノリン環の1位に<math>C1\sim6$ アルキル基が置換していてもよい):
- 25 (Fda35) 5-チアゾリルメチル基(チアゾール環上には、ハロゲン置換もしく は未置換のフェニル基及びC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基の少な くとも1種が置換していてもよい);又は
 - (Fda36) 5-(1H) -テトラゾリルC1~6アルキル基(テトラゾール環の 1位にハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基及びC1~6アルキル基からな

る群より選ばれた基が置換していてもよい)を示す。)

(Fd37) 一般式 (Fe') で表される基:

$$-Z-NR^{32}R^{33}$$
 (Fe')

(式中、Zは-C=O又は-C=Sを示す。R 32 及びR 33 は、同一又は異なって

(Fe1) 水素原子:

5

20

- (Fe2) C1~6アルキル基;
- (Fe3) C5~8シクロアルキル基;
- (Fe5) フェニルC 2~6Tルケニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6Tルキル基及びハロゲン置換もしくは未置り 換のC 1~6Tルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい): 又は
 - (Fe6) フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)を示す。
- (Fe7) 或いは、R³²及びR³³は、隣接する窒素原子と共に他の炭素原子を介して互いに結合してピペリジン環又は1,2,3,6ーテトラヒドロピリジン環を形成してもよい。該ピペリジン環及び1,2,3,6ーテトラヒドロピリジン環の4位には、フェニル基が置換してもよく、該フェニル基にはハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。)を示す。)

(Fd38) 一般式 (Ff') で表される基:

$$-N = C < R^{34}$$
 (Ff')

15

20

25

1052

(式中、 R^{34} は水素原子又は $C1\sim6$ 低級アルキル基を示す。 R^{35} は

- (Ff1) C5~8シクロアルキル基;
- (Ff2) C5~8シクロアルケニル基:
- (Ff3) 一般式 (Ffa') で表される基:

 $\begin{array}{c}
R^{36} \\
R^{37}
\end{array}$ (Ffa')

(ここで、 R^{36} 、 R^{37} 及び R^{38} は、各々水素原子; $C1\sim6$ アルキル基;フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキン基、メチレンジオキシ基、メタンスルホニル基、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキルチオ基、ニトロ基及びアセチルアミノ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が $1\sim5$ 個置換していてもよい);2-ベンゾフラニル基(ベンゼン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);4-ビフェニリル基;4-クロロフェニル基が置換していてもよい2-フリル基;又は2-(4-クロロフェニル)-4-チアゾリル基を示す。)

(Ff4) フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子;ハロゲン置換もしくは 未置換のC1~6アルキル基; C5~8シクロアルキル基; ヒドロキシ基;ハロゲン置換もしくは未置換のC1~8のアルコキシ基; C5~8シクロアルコキシ基;メチレンジオキシ基;エチレンジオキシ基;シアノ基;ニトロ基;シンナミル基; C1~6アルカノイルオキシ基; C1~6アルカノイルアミノ基;メタンスルホニルアミノ基;フェニルC1~6アルコキシ基;フェノキシ基;ジ (C1~6アルキル) アミノC1~6アルコキシ基;メトキシカルボニル基; C1~6アルコキシ上,メトキシカルボニルとC1~6アルコキシ基; C1~6アルコキシ基; C1~6アルコキシ基; C1~6アルコキシ基; C1~6アルコキシ基; C1~6アルコキシ基; C1~6アルカルボニルとC1~6アルコキシ基; C1~6アルキルチオ基; ピロリル基; 1ーイミダゾリル基; ピペリジノ基; モルホリノ基; ピロリジニル基; 2ーチエニル基; 2ーベンゾフラニル基; 1位がC1~6アルキル基、フェニルC1~6アルキル基、ベンゾイル基及びC1~6アルキル基置換ベンゾイル基からなる群より選ばれた基

で置換していてもよい4-ピペラジニル基;ベンゼン環上にC1~6アルコキシ 基が置換していてもよい2-オキソー3-キノリル基;4-(カルボスチリルー 1-イル)ピペリジニルー1-カルボニル基及びトリアゾリル基からなる群より 選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);

- 5 (Ff5) ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基又 はジメチルアミノ基が置換した1-又は2-ナフチル基;
 - (Ff6) $3-又は4-ビフェニリル基(ビフェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の<math>C1\sim9$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい):
 - (Ff7) 2-フルオレニル基: 3-ピレニル基:
 - (Ff8) 2 ベンゾフラニル基 (ベンゼン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していても
- 15 よい);

10

- (Ff9) 2-又は3-ベンゾチオフェニル基(ベンゼン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1 種が置換していてもよく、チオフェン環の3位又は2位が $C1\sim6$ アルキル基で置換して
- 20 いてもよい):
 - (Ff10) 2、3、又は4-ピリジル基(これらのピリジル基上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基、フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた
- 25 基が1~2個置換していてもよい)、2-フリル基、3-フリル基、2-チェニル基及び3-チェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。);
 - (Ff11) 2又は3-フリル基(これらフラン環上には、C1~6のアルキル基、 ニトロ基及びフェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もし

くは未置換の $C1\sim6$ アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換の $C1\sim6$ アルコキシ基及びニトロ基からなる群より選ばれた基が $1\sim3$ 個置換していてもよい) からなる群より選ばれた基が $1\sim3$ 個置換していてもよい) :

- (Ff12) 2-(2-メトキシフェニル) ベンゾチアゾール-5-イル基:
- 5 (Ff13) 2ーチエニル基;3ーチエニル基;4ープロモー2ーチエニル基;5ークロロー2ーチエニル基;5ーエチルー2ーチエニル基;3ーメチルー2ーチエニル基、5ーニトロー2ーチエニル基;5ー(1ーメチルー3ートリフルオロメチルー5ーピラゾリル)ー2ーチエニル基;5ー(1ーメチルー5ートリフルオロメナルー3ーピラゾリル)ー2ーチエニル基;2,2'ービチエンー5ーイル
- 10 基;5'ーブロモー2,2'ービチエンー5ーイル基、

(Ff14) 1-(4-メチルベンゼンスルホニル) インドール-3-イル基;1-ベンジルインドール-3-イル基;6-メトキシカルボニルインドール-3-イル基;2-フェニルインドール-3-イル基;

(Ff15) 1-(3-)リフルオロメチル)フェニル-2, 5-ジメチル<math>-3-ピ

- 15 ロリル基:
 - (Ff16) 6-クマリル基:
 - (Ff17) 2- (2-チエニル) 5-ベンゾイミダゾリル基; 6-ベンゾイミダ ゾリル基;
 - (Ff18) 2-(4-クロロフェニル) 4-オキサゾリル基;
- 20 (Ff19) 2-7ェニルー4-4アゾリル基; 2-(4-6)ロロフェニル) -4-4チアゾリル基; 2-(4-2) (4-ビフェニリル) -4-4アゾリル基:
 - (Ff20) 2-チアゾリル基;
 - (Ff21) 2-又は4-キノリニル基:
- 25 (Ff22) 8-メトキシ-3, 4-ジヒドロカルボスチリル-5-イル基;8-メトキシ-1-メチル-3, 4-ジヒドロカルボスチリル-5-イル基;8-ベンジルオキシ-3, 4-ジヒドロカルボスチリル-5-イル基;8-メトキシカルボスチリル-5-イル基;8-メトキシー1-メチルカルボスチリル-5-イル基;8-メトキシー3, 4-基;8-ベンジルオキシカルボスチリル-5-イル基;8-メトキシ-3,4-

ジヒドロカルボスチリルー6ーイル基;8ーメトキシー1ーメチルー3,4ージ ヒドロカルボスチリルー6ーイル基;8ーベンジルオキシー3,4ージヒドロカ ルボスチリルー6ーイル基;8ーメトキシカルボスチリルー6ーイル基;8ーメ トキシー1ーメチルカルボスチリルー6ーイル基;8

- 5 チリルー6ーイル基;
 - (Ff23) 6-イミダゾ [2, 1-b] チアゾリル基;
 - (Ff24) 2-イミダゾ [2, 1-a] ピリジル基;
 - (Ff25) 2, 2-ジメチル-6-クロマニル基; 又は
 - (Ff26) 2、3-ジヒドロ-5-ベンゾフラニル基を示す。)
- 10 F12-3) モルホリノ基;
 - F12-4) 1ーイミダゾリル基;
 - F12-5) 1, 4-ジオキサ-8-アザスピロ[4, 5]-8-デシル基;
 - F12-6) 4-tertーブトキシカルボニル-1-ホモピペラジニル基;4-ベンジルオキシカルボニル-1-ホモピペラジニル基;4-(4-ビフェニリル)
- 15 -1-ホモピペラジニル基、
 - F12-7) 1-tert-ブチルー2-ピペラジノンー4-イル基; 1-(4-トリフルオロメチルベンジル) -2-ピペラジノンー4-イル基;
 - F12-8) 4-オキソー1-ピペリジニル基;
 - F12-9) 2- (4-トリフルオロメトキシフェノキシメチル)ピロリジン-1-
- 20 イル基;
 - F12-10) 2-イソインドリニル基;
 - F13) 更に、 R^{19} 及び R^{20} は、隣接する窒素原子と共にヘテロ原子を介しもしくは介することなく互いに結合して、下記F13-1)~F13-11)に示す環状イミド又はアミドを形成していてもよい。
- 25 F13-1) 2-スクシンイミド基;
 - F13-2) 2-オキソオキサゾリン-3-イル基;
 - F13-3) 2-オキソベンゾー1,3-オキサゾリジン-3-イル基;5-ブロモ -2-オキソベンゾー1,3-オキサゾリジン-3-イル基;5-クロロ-2-オキソベンゾー1,3-オキサゾリジン-3-イル基;5-フェニル-2-オキ

ソベンゾー1, 3ーオキサゾリジン-3-イル基:

F13-4) 2-オキソイミダゾリジン-1-イル基(2-オキソイミダゾリジン-1-イル基の3位には、フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子及びメトキシ基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよ

5 い) 又はフェニル基が置換していてもよい) :

F13-5) 2ーオキソベンゾイミダゾリジン-1ーイル基(ベンゼン環上にハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ジメチルアミノ基又はエトキシカルボニル基が置換していてもよく、イミダゾリジン環の3位にはC1~6アルキル基;ハロゲン原子が1~3個置換していてもよいフェニル基:

- 10 tertーブトキシカルボニル基及びベンジルオキシカルボニル基からなる群より選ばれた基が置換してもよい4-ピペリジニル基が置換していてもよい);
 - F13-6) フタルイミドー2-イル基:

F13-7) 3位にメチル基又はフッ素原子が2個置換したオキシインドール-1- : イル基;

15 F13-8) ベンゾイックスルフィミド-2-イル基:

F13-9) 1H-2, 4-ベンゾオキサジン-3(4H)-オン-4-イル基:

F13-10) 一般式 (Fga') で表される基:

$$0 \longrightarrow 0 \qquad \text{(Fga')}$$

- 20 (式中、R³⁹は、水素原子;ハロゲン置換もしくは未置換のフェニルC1~6 アルキル基;ハロゲン置換もしくは未置換のフェノキシメチル基;ハロゲン置換 もしくは未置換のスチリル基;ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基から なる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよいフェニル基;ビフ 25 ェニリル基;4ーピリジル基又は2-ピラジニル基を示す。)
- F13-11) 5-(4-トリフルオロメチルベンジリデン)-1,3-チアゾリジンー2、4-ジオン-3-イル基:

一般式 (G') で表される基:

(式中、R⁴⁰は、C1〜6アルキル基又はハロゲン置換もしくは未置換のフェ 5 ニル基を示す。)

一般式(H')で表されるスピロ環基;

(式中、R⁴¹は、

- 10 H1) 水素原子;
 - H2) C1~6アルキル基;
 - H3) フェニルC1~6アルキル基又は4-ビフェニリルC1~6アルキル基;
 - H4) フェニル基 (ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基が置換していてもよい);
- 15 H5) 4-置換-1-ピペラジニルC1~6アルキル基(4位の置換基がC1~6アルコキシカルボニル基、4ービフェニリルメトキシカルボニル基又はベンジルオキシカルボニル基であり、該ベンジルオキシカルボニル基はベンゼン環上にハロゲン、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~3個置
- 20 換していてもよい)
 - H6) $4位がC1\sim6$ アルコキシカルボニル、4-トリフルオロメチルベンジル オキシカルボニル、4-トリフルオロメチルベンジル基又はビフェニリルメチル 基で置換された4-置換-1-ピペラジニルカルボニル $C1\sim6$ アルキル基;
 - H7) 4-トリフルオロメチルフェニルカルバモイルC1~6アルキル基;
- 25 H8) 2-ベンゾオキサゾロン-1-イルプロピル基;
 - H9) 2-ベンゾチアゾリル基;
 - H10) 1-フェニル-5-テトラゾリル基:
 - H11) メタンスルホニル基;
 - H12) ベンゼンスルホニル又はp-トルエンスルホニル基;

- H13) フェニル環の4位にハロゲン原子が置換していてもよいフェニルチオカルバモイル基;
- H14) C1~8のアルコキシカルボニル基;
- H15) フェニルC1~6アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン
- 5 原子、C1~6アルコキシカルボニル基、C1~6アルコキシカルボニルアミノ 基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは 未置換のC1~6アルコキシ基、ニトロ基及びメチルチオ基からなる群より選ば れた基の少なくとも1種が置換していてもよい):
 - H16) ベンズヒドリルオキシカルボニル基(フェニル環上にハロゲン原子が1~
- 10 4個置換していてもよい);
 - H17) 4-ビフェニリルメトキシカルボニル基:
 - H18) ナフチルメトキシカルボニル基:
 - H19) ピリジルメトキシカルボニル基:
 - H20) メトキシエトキシカルボニル基;
- 15 H21) 4位に $C1\sim6$ アルコキシカルボニル基又はハロゲン置換もしくは未置換のフェニル $C1\sim6$ アルコキシカルボニル基が置換していてもよい2-(1-1) ペラジニル)エトキシカルボニル基;
 - H22) フェノキシカルボニル基(フェニル環上には、 $C1\sim6$ アルキル基及び $C1\sim6$ アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していて
- 20 もよい);
 - H23) C1~6アルカノイル基:
 - H24) ベンゾイル基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基の少なくとも1種が置換していてもよい);
 - H25) フェニルC2~6アルカノイル基(フェニル環上には、ハロゲン置換もし
- 25 くは未置換のC1~6アルキル基の少なくとも1種が置換していてもよい)、
 - H26) フェノキシC 2~6 アルカノイル基(フェニル環上にハロゲン原子が1~3 個置換していてもよい);
 - H27) 4-置換-1-ピペラジニルC2~6アルカノイル基(4位の置換基がC1~6アルカノイル基、フェニルC1~6アルキル基、4-ビフェニリルメチル

基、フェニルC1~6アルコキシカルボニル基、フェニルカルバモイルメチル基、フェニルカルバモイル基又は2ーベンゾオキサゾリル基であり、該フェニルC1~6アルキル基、フェニルC1~6アルコキシカルボニル基、フェニルカルバモイルメチル基及びフェニルカルバモイル基の各フェニル環上にはハロゲン、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい)

H28) フェニルカルバモイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ジメチルアミノ基、カルボキシル基、C1~6アルコキシカルボニル基、ハロゲン置換もしては未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基、4-メチル-1-ピペラジニル基及びモルホリノ基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい);

H29) ベンジルカルバモイル基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ

15 基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);又は H30) 4位にtertーブトキシカルボニル基、4ートリフルオロメチルベンジルオ キシカルボニル基又は4ートリフルオロメチルベンジル基で置換された4ー置換 - 1 - ピペラジニルカルボニル基を示す。

但し、 R^1 が水素原子を示し、 R^2 が一般式(A')で表される基を示す場合、 R^3 はイソプロピル基であってはならない。また、 R^1 が水素原子を示し、 R^2 が一般式(E')で表される基を示し、mが 0を示す場合、 R^{11} は水素原子であってはならない。更に、 R^1 が水素原子を示し、 R^2 が一般式(F')で表される基を示す場合、 R^{19} は水素原子を示し且つ R^{20} がtertーブトキシカルボニル基を示してはならない。]。

- 25 3. R^2 が一般式 (A) である特許請求の範囲第1項記載の2, 3-ジヒドロ -6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体 又はそれらの薬理学的に許容される塩。
 - 4. R^2 が一般式 (B) である特許請求の範囲第1項記載の2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体

又はそれらの薬理学的に許容される塩。

- 5. R^2 が一般式(C)である特許請求の範囲第1項記載の2、3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。
- 5 6. R^2 が一般式 (D) である特許請求の範囲第1項記載の2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。
 - 7. R^2 が一般式(E)である特許請求の範囲第1項記載の2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。
 - 8. R^2 が一般式 (F) である特許請求の範囲第1項記載の2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。
- 9. R^2 が一般式(G)である特許請求の範囲第1項記載の2,3-ジヒドロ 15 -6-ニトロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体 又はそれらの薬理学的に許容される塩。
- 10. R¹及び-(CH2) nR²が隣接する炭素原子と共に窒素原子を介して 互いに結合して形成する一般式(H)で表されるスピロ環である特許請求の範囲 第1項記載の2,3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2,1-b]オキサゾー 20 ル化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。
 - 11. nが 0である特許請求の範囲第 $3 \sim 1$ 0 項記載の 2, 2 ジヒドロ- 6 ニトロイミダゾ [2, 1 b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。
- 12. nが1~6である特許請求の範囲第3~10項記載の2,3-ジヒドロー 25 6-ニトロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又 はそれらの薬理学的に許容される塩。
 - 13. R^1 が水素原子である特許請求の範囲第3~10項記載の2,3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。

14. R^1 が $C1\sim6$ のアルキル基である特許請求の範囲第 $3\sim1$ 0項記載の2, 3-ジヒドロ-6ーニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。

15. R^{11} が (E1) \sim (E3) である特許請求の範囲第7項記載の2,3-5 ジヒドロ-6ーニトロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。

16. R^{11} が (E4) である特許請求の範囲第7項記載の2, 3-ジヒドロー 6-ニトロイミダブ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又 はそれらの薬理学的に許容される塩。

10 17. R^{11} が (E 5) \sim (E 9) である特許請求の範囲第7項記載の2, 3 - ジヒドロ-6 - ニトロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。

18. R¹¹が (E10) である特許請求の範囲第7項記載の2, 3ージヒドロー6ーニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体15. 又はそれらの薬理学的に許容される塩。

19. R^{11} が (E 1 1) である特許請求の範囲第7項記載の2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。

20. R^{11} が (E12) である特許請求の範囲第7項記載の2, 3-ジヒドロ 20 -6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体 又はそれらの薬理学的に許容される塩。

21. R^{11} が (E 1 3) である特許請求の範囲第7項記載の2, 3-ジヒドロ -6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体 又はそれらの薬理学的に許容される塩。

25 22. R^{11} が $(E14) \sim (E17)$ 及び $(E19) \sim (E22)$ である特許 請求の範囲第7項記載の2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。 23. R^{11} が (E18) である特許請求の範囲第7項記載の2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体

又はそれらの薬理学的に許容される塩。

24. R^{19} 及び R^{20} が、同一又は異なって(F 1)~(F 1 1)である特許請求の範囲第8項記載の 2,3 -ジヒドロ-6 -ニトロイミダゾ [2,1 - b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。

- 5 25. R^{19} 及び R^{20} が、隣接する窒素原子と共に他のヘテロ原子もしくは炭素原子を介しもしくは介することなく形成する複素環が(F 1 2 3) \sim (F 1 2 1 0)又は(F 1 3)である特許請求の範囲第8項記載の2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。
- 10 26. R^{19} 及び R^{20} が、隣接する窒素原子と共に他のヘテロ原子もしくは炭素原子を介しもしくは介することなく形成する複素環が(F 1 2 1)である特許請求の範囲第8項記載の2,3 ジヒドロ- 6 - トロイミダゾ [2, 1 b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。
- 15 27. R^{19} 及び R^{20} が、隣接する窒素原子と共に他のヘテロ原子もしくは炭素原子を介しもしくは介することなく形成する複素環が(F 1 2 2)である特許請求の範囲第8項記載の2、3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。
- 20 28. oが 0 である特許請求の範囲第18項記載の 2, 3 ジヒドロー 6 ニトロイミダゾ [2, 1 b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。
- 29. oが1でWが基一CO-である特許請求の範囲第18項記載の2,3-ジ ヒドロー6-ニトロイミダブ [2,1-b] オキサゾール化合物、それらの光学 25 活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。
 - 30. o が 1 でWが C 1 \sim 6 アルキレン基である特許請求の範囲第 1 8 項記載の 2 , 3 ジヒドロ- 6 ニトロイミダゾ [2 , 1 b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。
 - 31. R^{14} が(Eaa1)~(Eaa2)、又は(Eaa4)~(Eaa2

- 7) である特許請求の範囲第18項記載の2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダ ブ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学 的に許容される塩。
- 32. R^{14} が (Eaa3) である特許請求の範囲第18項記載の2, 3-ジヒ 5 ドロ-6-ニトロイミダブ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。
 - 33. oが0である特許請求の範囲第19項記載の2,3-ジヒドロー6-ニトロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。
- 10 34. oが1である特許請求の範囲第19項記載の2,3-ジヒドロー6-ニトロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。
 - 35. R^{26} が(Fd1)~(Fd35)、(Fd37)又は(Fd39)である特許請求の範囲第27項記載の2、3-ジヒドロー6ーニトロイミダゾ <math>[2、
- 15 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。
 - 36. R^{26} が (Fd36) である特許請求の範囲第27項記載の2,3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。
- 20 37. R^{26} が (Fd38) である特許請求の範囲第27項記載の2,3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。
 - 38. R^{27} が (Fda1) \sim (Fda5) 又は (Fda7) \sim (Fda34) である特許請求の範囲第36項記載の2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ
- 25 [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的 に許容される塩。
 - 39. R^{27} が (Fda6) である特許請求の範囲第36項記載の2,3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。

- 40. R³⁵が(Ff1)~(Ff3)、(Ff5)~(Ff7)又は(Ff9)~(Ff26)である特許請求の範囲第37項記載の2,3ージヒドロー6ーニトロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。
- 5 41. R^{35} が (Ff4) である特許請求の範囲第37項記載の2, 3-ジヒド u-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性 体又はそれらの薬理学的に許容される塩。
 - 42. R^{35} が (Ff8) である特許請求の範囲第37項記載の2, 3-ジヒドロー6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。
 - 43. 4-(2-メチル-6-ニトロ-2、3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸3-(4-トリフルオロメチルフェニル) -2-プロペニルエステル、
 - (S) -4-(2-メチルー6-ニトロー2、3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-
- 15 b]オキサゾールー2ーイルメチル)ピペラジンー1ーカルボン酸3ー(4ートリフルオロメチルフェニル)ー2ープロペニルエステル、
 - (R) -4-(2-メチル-6-ニトロ-2、3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸 <math>3-(4-トリフルオロメチルフェニル) -2-プロペニルエステル、
- 20 2-メチルー6-ニトロー2- $\{4-$ [4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジンー1-イル] フェノキシメチル $\}-2$ 、3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b] オキサゾール、
- (S) -2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェノキシメチル} -2、3-ジヒドロ
 25 イミダゾ [2、1-b] オキサゾール、
 - $(R) 2 \lambda + \mu 6 \mu 2 \{4 [4 (4 \mu \mu \mu \mu + \mu 2 4 \mu \mu 2 \mu$
 - 2-メチルー6-ニトロー2ー {4- [1- (4-トリフルオロメトキシベンジ

- ル) \mathbb{C}^{n} $\mathbb{C}^$
- (S) -2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-[1-(4-$ トリフルオロメトキシベンジル)ピペリジン-4-イル]フェノキシメチル $\}-2$ 、3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b] オキサゾール、

6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリ

- 15 (R) -6-ニトロ-2- {4- [4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェノキシメチル} -2、3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-[3-(4-$ トリフルオロメトキシフェノキシ) -8-アザビシクロ [3.2.1] オクタン-8-イル] フェノキシメチ

- 20 ν 2、3 ジヒドロイミダゾ [2, 1 b] オキサゾール、
 - (S) -2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-[3-(4-$ トリフルオロメトキシフェノキシ) -8-アザビシクロ [3. 2. 1] オクタン-8-イル] フェノキシメチル $\}$ -2、3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、
 - (R) -2-メチル-6-ニトロ-2- {4-[3-(4-トリフルオロメトキ
- 25 シフェノキシ) -8-アザビシクロ[3.2.1] オクタン-8-イル] フェノキシメチル} -2、3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b] オキサゾール、
 - $(R) 2 \lambda f \nu 6 \mu 2 \{4 [3 (4 \mu) \tau \nu + \nu 2 (4 \mu) \tau \nu 2 (4 \mu) \tau \nu + \nu \nu + \nu \nu 2 (4 \mu) \tau \nu -$

ルエンスルホン酸塩、

2-メチルー6-ニトロー2- [4-(4-トリフルオロメチルベンジリデンアミノ) ピペラジンー1-イル]-2、3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

- 5 (S) -2-メチル-6-ニトロー2-[4-(4-トリフルオロメチルベンジリデンアミノ)ピペラジン-1-イル]-2、3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール、
- 10 b] オキサゾール、

- (S) -2- [4-(5-クロロベンゾフラン-2-イルメチレンアミノ) ピペ
- 15 ラジン-1-イル] -2-メチル-6-ニトロ-2、3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、
- 20 2-[4-(5-1)] 2-1 2-1 1-1
 - (S) -2-[4-(5-h)]フルオロメチルベンゾフラン-2-hルメチレンアミノ)ピペラジン-1-hル] -2-xチル-6-h0-1トロ-2、3-y1 ドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、
 - (R) 2 [4 (5 h)] フルオロメチルベンゾフラン- 2 4 ルメチレンアミノ)ピペラジン- 1 4 ル] 2 4 チル- 6 2 、3 5 ドロイミダゾ [2, 1 b] オキサゾール、

2-メチルー6-ニトロー2- {4- [4-(4-トリフルオロメチルベンジ

- (2, 1-b) オキサゾール、
- (S) -2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイミ ダゾ [2, 1-b] オキサゾール、
 - $(R) 2 \lambda + \pi 6 \pi 1 2 \{4 [4 (4 1) 1) 1 4 1]$ ベンジル) ピペラジン- 1 4 1 フェノキシメチル- 2, 3 3 1 1 1 ダゾ [2, 1 1] オキサゾール、
 - 2-メチルー6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメトキシベンジ
- 10 ル) ピペラジンー1ーイル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b] オキサゾール、
- 15 (R) -2-メチル-6-ニトロ-2- {4-[4-(4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、
 - 2-メチル-6-ニトロ-2- [4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジン-1-イルメチル]-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサ
- 20 ゾール、
 - (S) -2-メチル-6-ニトロ-2- [4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジン-1-イルメチル] -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、
 - (R) -2-メチル-6-ニトロ-2- [4-(4-トリフルオロメチルフェノ
- 25 キシ)ピペリジン-1-イルメチル] -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、
 - 2-[4-(4-h)] フルオロメトキシフェニル) ピペラジン-1-h ル] -2-x チル-6- ニトロ-2 、3- ジヒドロイミダゾ [2 、1- b] オキサゾール、

- (S) -2-[4-(4-h)] フルオロメトキシフェニル) ピペラジン-1-A ルメチル] -2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、
- - (S) -2-[4-(4-クロロフェニル) ピペラジン-1-イルメチル] -2
- 10 ーメチルー6ーニトロー2、3ージヒドロイミダゾ [2、1ーb] オキサゾール、(R) ー2ー [4ー(4ークロロフェニル) ピペラジンー1ーイルメチル] ー2ーメチルー6ーニトロー2、3ージヒドロイミダゾ [2、1ーb] オキサゾール、2ーメチルー6ーニトロー2ー [4ー(4'ートリフルオロメチルビフェニルー4ーイルメチル) ピペラジンー1ーイルメチル] ー2、3ージヒドロイミダゾ
 15 [2、1-b] オキサゾール、
- (S) −2−メチル−6−ニトロ−2− [4− (4'−トリフルオロメチルビフェニル−4−イルメチル) ピペラジン−1−イルメチル] −2, 3−ジヒドロイミダゾ [2, 1−b] オキサゾール、
- - 2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-$ [4-(4-トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル $\}$ -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、
- 25 (S) -2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-$ [4- (4-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジン-1-イル]フェノキシメチル $\}$ -2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b] オキサゾール、
 - (R) -2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-$ [4- (4-トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル $\}$ -2, 3-ジヒドロイミ

- b] オキサゾール、

10

ダゾ[2,1-b]オキサゾール、

2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-$ [4- (4-クロロベンジル) ピペラジン -1-イル] フェノキシメチル $\}-2$, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オ キサゾール、

- 5 (S) -2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-$ [4-(4-クロロベンジル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル $\}$ -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、
 - (R) -2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-$ [4- (4-クロロベンジル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル $\}-2$, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1
- 2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-[4-(4-$ クロロフェニル) ピペラジン -1-イル] フェノキシメチル $\}$ -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール
- (S) -2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (4-クロロフェニル) ピ
 15 ペラジン-1-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、
 - (R) -2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-$ [4- (4-クロロフェニル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル $\}$ -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、
- 20 2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-$ [4-(4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル)ピペラジン-1-イル]フェノキシメチル $\}-2$, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール、
 - (S) -2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-$ [4-(4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル $\}-2$,
- 25 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、
 - (R) -2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-$ [4-(4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル $\}-2$, 3-ジヒドロイミダブ [2, 1-b] オキサゾール、
 - 2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-$ [4-(3, 4-ジクロロベンジルオキシ

カルボニル) ピペラジンー1ーイル] フェノキシメチル $\}$ -2, 3ージヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

- (S) -2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-$ [4- (3, 4-ジクロロベンジ ルオキシカルボニル)ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル $\}-2$, 3-ジ ヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、
- $(R) 2 \lambda f \mathcal{V} 6 2 \{4 [4 (3, 4 \mathcal{V}) 2 (4 (3, 4 \mathcal{V}) 2 (4 (3, 4 \mathcal{V}) 2, 3 \mathcal{V})\}$ $\mathcal{V} = (4 (3, 4 \mathcal{V}) (3, 4 \mathcal{V}) (4 (3, 4 2) (4 2) (4 (3, 4 2) (4 2) (4 (3, 4$

2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)

- 10 ピペリジン-1-イルメチル] -2, 3-ジヒドロイミダブ [2, 1-b] オキサゾール:
 - (S) -2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(4-トリフルオロメトキシフェーノキシ)ピペリジン-1-イルメチル] -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1- b] オキサゾール、
- 15 (R) -2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン-1-イルメチル] -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン-1-イルメチル] -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾ

- 20 ール、
 - (S) -2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン-1-イルメチル] -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、
- (R) -2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(4-トリフルオロメチルフェニ25 ル)ピペラジン-1-イルメチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール、

2-メチルー6-ニトロー2- [4-(5-トリフルオロメトキシベンゾフラン -2イルメチレンアミノ) ピペラジン-1-イルメチル] -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

ダゾ「2,1-b]オキサゾール、

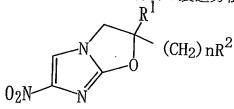
ドロイミダゾ「2.1-b] オキサゾール、

- (S) -2-メチル-6-ニトロ-2- [4-(5-トリフルオロメトキシベン ゾフラン-2イルメチレンアミノ) ピペラジン-1-イルメチル]-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b] オキサゾール、
- (R) -2-メチルー6-ニトロー2- [4-(5-トリフルオロメトキシベン
 5 ゾフランー2イルメチレンアミノ) ピペラジンー1ーイルメチル] -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、
 2-メチルー6-ニトロー2- [4-(5-トリフルオロメチルベンゾフランー2イルメチレンアミノ) ピペラジンー1ーイルメチル] -2, 3-ジヒドロイミ
- 10 (S) -2-メチル-6-ニトロ-2- [4-(5-トリフルオロメチルベンゾフラン-2イルメチレンアミノ) ピペラジン-1-イルメチル] -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

 - 2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-$ [4-(4-クロロフェノキシ) ピペリジ $\nu-1-4\nu$] フェノキシメチル $\{-2, 3-$ ジヒドロイミダブ [2, 1-b] オキサゾール、
- (S) $-2-メチル-6-ニトロ-2-\{4-[4-(4-クロロフェノキシ)$ 20 ピペリジン-1-イル] フェノキシメチル $\}$ -2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b] オキサゾール、
 - (R) $-2-メチル-6-=トロ-2-\{4-[4-(4-クロロフェノキシ)$ ピペリジン-1-イル] フェノキシメチル $\}-2$, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、
- 25 2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-$ [4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェノキシメチル $\}$ -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、
 - (S) -2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-[4-(4-$ トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェノキシメチル $\}-2$, 3-ジヒドロイ

ミダゾ[2,1-b]オキサゾール、

- 5 2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-$ [1- (4-クロロベンジル) ピペリジン -4-イル] フェノキシメチル $\}$ -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オ キサゾール、
 - (S) -2-メチル-6-ニトロ-2- $\{4-[1-(4-$ クロロベンジル) ピペリジン-4-イル] フェノキシメチル $\}$ -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールマけ
 - $(R) 2 メチルー 6 ニトロー 2 \{4 [1 (4 クロロベンジル) ピペリジンー 4 イル] フェノキシメチル <math>\} 2$, 3 ジヒドロイミダゾ [2, 1 b] オキサゾール。
- 44. 請求項1に記載の2, 3-ジヒドロー6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] 15 オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を有効成分として含有する、抗結核剤である医薬組成物。
 - 45. 請求項43に記載の2、3-ジヒドロー6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物から選ばれる少なくとも1つの化学物を有効成分として含有する、抗結核剤である医薬組成物。
- 20 46. 一般式 (1 a) で表される化合物の製造方法であって



(1a)

25 (式中、 R^1 、 R^2 及びn は請求項1 において定義したものと同じである。)、 一般式(2)で表される4ーニトロイミダゾール化合物

$$0_2N$$
 X_1
 X_1

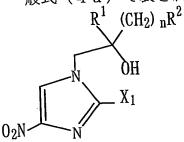
(式中、 X_1 はハロゲン原子又はニトロ基を示す。) と、 5

一般式 (3 a) で表されるエポキシ化合物

$$0 \underbrace{\begin{array}{c} R^1 \\ (CH_2)_n R^2 \\ (3a) \end{array}}$$

10

(式中、 R^1 、 R^2 及びnは請求項1において定義したものと同じである。)と を反応させて、一般式 (4 a) で表される化合物



15

20

(4a) (式中、 \mathbf{R}^1 、 \mathbf{R}^2 及び \mathbf{n} は請求項 $\mathbf{1}$ において定義したものであり、 \mathbf{X}_1 はハロ ゲン原子又はニトロ基を示す。)を得、次いで得られた一般式 (4 a)で表され る化合物を閉環させることにより製造する、当該製造方法。

47. 一般式(1 b)で表される化合物の製造方法であって

$$R^1$$
 O_2N
 N
 O_2N
 O_2N
 O_2N
 O_3N
 25

(式中、 R^1 は請求項1において定義したものと同じであり、 R^2 a は請求項1において定義した一般式 (A)、(B)、(E)又は(F)で表される基を示 す。)、

15

25

一般式(3b)で表される化合物

$$0_2N$$
 N
 0
 X_1
 X_1
 X_2
 X_3
 X_4
 X_4
 X_4
 X_4
 X_5
 X

(式中、 R^1 は請求項1において定義したものと同じであり、 X_1 はハロゲン原子又はニトロ基を示す。)と、

一般式(5)で表される化合物R^{2a}H(5)又はその塩(R^{2a}は、請求項10 1において定義した一般式(A)、(B)、(E)又は(F)で表される基を示す。)とを反応させて、

一般式(4b)で表される化合物

$$\begin{array}{c|c}
R^1 & \text{CH}_2R^{2a} \\
N & \text{OH} \\
0_2N & N
\end{array}$$

(4b)

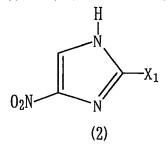
 $(R^1$ は請求項1において定義したものと同じであり、 R^{2a} は請求項1において定義した一般式 (A)、(B)、(E)、又は(F)で表される基を示し、 X^{2a} ないで一般式 (A) で表される基を示し、(A) ないで一般式 (A) で表される化合物を閉環させることにより製造する、当該製造方法。

48. 一般式(1 c)で表される化合物の製造方法であって

$$0_2N$$
 R^{41}
 $(1c)$

(式中、R⁴¹は請求項1において定義したものと同じである。)、

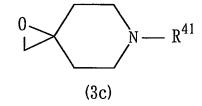
一般式(2)で表される化合物



5

(式中、 X_1 はハロゲン原子又はニトロ基を示す。) と、

一般式(3 c)で表される化合物

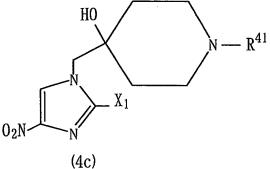


10

(式中、R 41 は請求項1において定義したものと同じである。)とを反応させて、

15

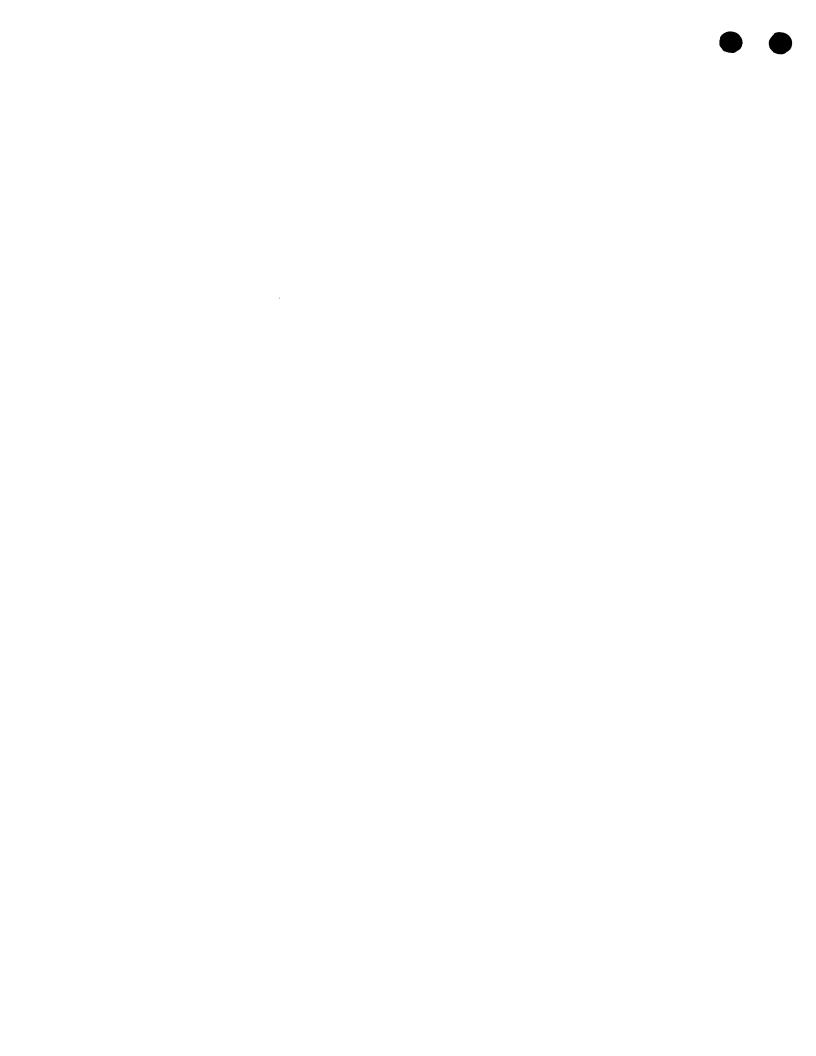
一般式(4 c)で表される化合物 HO



20

(式中、 R^{41} は請求項1において定義したものと同じであり、 X_1 はハロゲン原子又はニトロ基を示す。)を得、次いで得られた一般式(4c)で表される化合物を閉環させることにより製造する、当該製造方法。

25



INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/JP03/13070

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER Int.Cl ⁷ C07D498/04, 498/20, 519/00, A61K31/424, 31/454,31/4545, 31/4709, 31/496, 31/498, 31/4245, 31/4439, 31/497, 31/428, 31/4725, 31/438,31/551, 31/5377, 31/506, 31/695, 31/46, A61P31/06, C07F7/10 According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC					
B. FIELDS SEARCHED Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) Int.Cl ⁷ C07D498/04, 498/20, 519/00, A61K31/424, 31/454, 31/4545, 31/4709, 31/496, 31/498, 31/4245, 31/4439, 31/497, 31/428, 31/4725, 31/438, 31/551, 31/5377, 31/506, 31/695, 31/46, C07F7/10					
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched					
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used) CAPLUS (STN), CAOLD (STN), REGISTRY (STN)					
C. DOCU	MENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT				
Category*	Citation of document, with indication, where ap	propriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.		
A	SEHGAL, Raj K. et al., Potential radiosensitizing agents. 2. Synthesis and biological activity of derivatives of dinitro imidazole with oxiranes, Journal of Medicinal Chemistry, 1981, Vol.24, No.5, p.601-4, compounds 3d, 3e, scheme I		1-3,12,13,46 4-11,14-45, 47,48		
Α	ASHTEKAR, Dilip R. et al., In vitro and in vivo activities of the nitroimidazole CGI 17341 against Mycobacterium tuberculosis, Antimicrobial Agents and Chemotherapy, February, 1993, Vol.37, No.2, p.183-6, particularly, Fig. 1		1-48		
A	NAGARAJAN, Kuppuswamy et al., Nitroimidazoles. XXI. 2,3-Dihydro-6-nitroimidazo[2, 1-b]oxazoles with antitubercular activity, European Journal of Medicinal Chemistry, 1989, Vol.24, No.6, p.631-3, particularly, compounds No.3h, 3j		1-48		
▼ Furth	er documents are listed in the continuation of Roy C	See natent family anney			
Further documents are listed in the continuation of Box C. See patent family annex. * Special categories of cited documents: "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance "E" earlier document but published on or after the international filing date "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed Date of the actual completion of the international search 06 January, 2004 (06.01.04) *T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone considered to involve an inventive step when the document is considered to involve an inventive step when the document is considered to involve an inventive step when the document is considered to involve an inventive step when the document is considered to involve an inventive step when the document is considered to involve an inventive step when the document is considered to involve an inventive step when the document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document of considered to involve an inventive step when the document of the invention cannot be considered to involve an inventive step when the document of the invention cannot be considered to involve an inventive step when the document of the invention cannot be considered to involve an inventive step when the document of the invention cannot be considered to involve an inventive step when the document of the invention cannot be considered to involv			the application but cited to lerlying the invention claimed invention cannot be seed to involve an inventive claimed invention cannot be pwhen the document is a documents, such a skilled in the art family		
Name and mailing address of the ISA/ Japanese Patent Office		Authorized officer			
Facsimile No.		Telephone No.			

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No. PCT/JP03/13070

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT				
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages Relevant to			
A	WO 97/01562 A1 (PATHOGENESIS CORP.), 16 January, 1997 (16.01.97), & US 5668127 A	1-48		
	SA /210 (continuation of second short) (I.I. 1999)			

Form PCT/ISA/210 (continuation of second sheet) (July 1998)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/JP03/13070

Box I Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 2 of first sheet)				
This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:				
1. Claims Nos.: because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:				
Claims Nos.: because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:				
3. Claims Nos.: because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).				
Box II Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 3 of first sheet)				
This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows: The technical feature common to the inventions of claims 1-48 is a compound having the structure of the formula (I) as the partial chemical structure, but compounds having the common partial chemical structure are publicly known [see, e.g., SEHGAL, Raj K. et al., Journal of Medicinal Chemistry, 1981, Vol.24, No.5, pp.601-4]: (I)				
Thus, the inventions of claims 1-48 do not have any common technical feature beyond the prior art, and are therefore not considered as being so linked as to form a single general inventive concept. 1. As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.				
2. X As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.				
3. As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:				
4. No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:				
Remark on Protest The additional search fees were accompanied by the applicant's protest. No protest accompanied the payment of additional search fees.				

国際調査報告 国際出願番号 PCT/JP03/13070 発明の属する分野の分類(国際特許分類(IPC)) Int. Cl⁷ C07D498/04, 498/20, 519/00, A61K31/424, 31/454, 31/4545, 31/4709, 31/496, 31/498, 31/4245, 31/4439, 31/497, 31/428, 31/4725, 31/438, 31/551, 31/5377, 31/506, 31/695, 31/46, A61P31/06, C07F7/10 調査を行った分野 調査を行った最小限資料(国際特許分類(IPC)) Int. Cl⁷ C07D498/04, 498/20, 519/00, A61K31/424, 31/454, 31/4545, 31/4709, 31/496, 31/498, 31/4245, 31/4439, 31/497, 31/428, 31/4725, 31/438, 31/551, 31/5377, 31/506, 31/695, 31/46, C07F7/10 最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの 国際調査で使用した電子データベース(データベースの名称、調査に使用した用語) CAPLUS (STN), CAOLD (STN), REGISTRY (STN) 関連すると認められる文献 引用文献の 関連する 引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示 カテゴリー* 請求の範囲の番号 SEHGAL, Raj K. et al., Potential radiosensitizing agents. 2. X 1-3, 12, 13, 46 Synthesis and biological activity of derivatives of dinitro Α 4-11, 14-45, imidazole with oxiranes, Journal of Medicinal Chemistry, 198 47, 48 1, Vol. 24, No. 5, p. 601-4, 化合物 3 d 及び 3 e 、Scheme I参照 Α ASHTEKAR, Dilip R. et al., In vitro and in vivo activities o 1-48f the nitroimidazole CGI 17341 against Mycobacterium tubercu losis, Antimicrobial Agents and Chemotherapy, Feb. 1993, Vo 1.37, No.2, p.183-6, 特に、FIG.1参照 X C欄の続きにも文献が列挙されている。 * 引用文献のカテゴリー の日の後に公表された文献 「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示す 「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって 出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論 「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日 の理解のために引用するもの 以後に公表されたもの 「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明 「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行 の新規性又は進歩性がないと考えられるもの 日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する 「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以 文献 (理由を付す) 上の文献との、当業者にとって自明である組合せに 「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献 よって進歩性がないと考えられるもの 「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願 「&」同一パテントファミリー文献

国際調査報告の発送日

特許庁審査官(権限のある職員)

谷尾 忍

電話番号 03-3581-1101 内線 3491

27. 1. 2004

4 P

9550

日本国特許庁(ISA/JP)

郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

06.01.2004

国際調査を完了した日

国際調査機関の名称及びあて先

Y'

C(続き).	関連すると認められる文献 関連する				
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、	関連する 請求の範囲の番号			
A .	NAGARAJAN, Kuppuswamy et al., Nitroimida dro-6-nitroimidazo[2,1-b]oxazoles with a ty, European Journal of Medicinal Chemis o.6, p.631-3,特に、化合物No.3h及び	1-48			
A	WO 97/01562 A1 (PATHOGENESIS CORPORATION) & US 5668127 A & CA 2225822 A & AU 96639 & EP 866793 A1 & JP 11-508270 A & US 608	1-48			
,					
			•		
			•		
		·			
		•			
• •		· ·			
		:			

第 I 欄 請求の範囲の一部の調査ができないときの意見 (第1ページの2の続き) 注第 8 条第 3 項 (PCT 1 7 条 (V) ()) の 場合
法第8条第3項(PCT17条(2)(a))の規定により、この国際調査報告は次の理由により請求の範囲の一部について作成しなかった。
1. □ 請求の範囲は、この国際調査機関が調査をすることを要しない対象に係るものである。 つまり、
2. □ 請求の範囲 は、有意義な国際調査をすることができる程度まで所定の要件を満たしていない国際出願の部分に係るものである。つまり、
3. □ 請求の範囲 は、従属請求の範囲であってPCT規則6.4(a)の第2文及び第3文の規定に 従って記載されていない。
第Ⅱ欄 発明の単一性が欠如しているときの意見 (第1ページの3の続き)
次に述べるようにこの国際出願に二以上の発明があるとこの国際調査機関は認めた。
請求の範囲1-48記載の発明の共通する技術的特徴は、 ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・
上記構造を共通する部分化学構造として持つ化合物を有する点であるところ、前記共通の部分化学構造を有する化合物は公知である[例えば、SEHGAL, Raj K. et al., Journal of Med icinal Chemistry, 1981, Vol. 24, No. 5, p. 601-4参照]。してみると、請求の範囲1-48記載の発明は、先行技術を越えた共通の技術的特徴を有していないものと認められるから、請求の範囲1-48記載の発明は、単一の一般的発明概念を形成するように連関しているものではない。
1. 出願人が必要な追加調査手数料をすべて期間内に納付したので、この国際調査報告は、すべての調査可能な請求の範囲について作成した。
2. 図 追加調査手数料を要求するまでもなく、すべての調査可能な請求の範囲について調査することができたので、追 加調査手数料の納付を求めなかった。
3. □ 出願人が必要な追加調査手数料を一部のみしか期間内に納付しなかったので、この国際調査報告は、手数料の納付のあった次の請求の範囲のみについて作成した。
4. Ш 出願人が必要な追加調査手数料を期間内に納付しなかったので、この国際調査報告は、請求の範囲の最初に記載されている発明に係る次の請求の範囲について作成した。
追加調査手数料の異議の申立てに関する注意
様式PCT/ISA/210 (第1ページの続葉 (1)) (1998年7月)

This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning Operations and is not part of the Official Record

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

□ BLACK BORDERS
□ IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
□ FADED TEXT OR DRAWING
□ BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING
□ SKEWED/SLANTED IMAGES
□ COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS
□ GRAY SCALE DOCUMENTS
□ LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT
□ REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

OTHER:

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.

